

(19)



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets



(11) Veröffentlichungsnummer: **0 645 386 A1**

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 94114445.3

(51) Int. Cl.⁶: **C07D 413/12, C07D 413/14,
A01N 47/36**

(22) Anmeldetag: 14.09.94

(30) Priorität: 27.09.93 DE 4332796
29.10.93 DE 4336875

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:
29.03.95 Patentblatt 95/13

(84) Benannte Vertragsstaaten:
BE CH DE DK ES FR GB IT LI NL

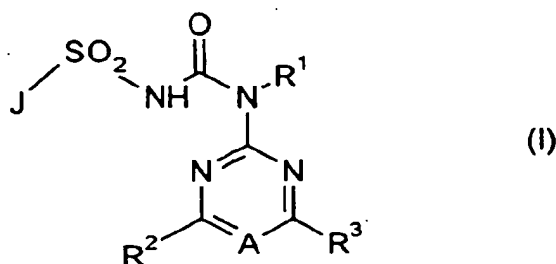
(71) Anmelder: **BAYER AG**

D-51368 Leverkusen (DE)

(72) Erfinder: **Philipp, Ulrich, Dr.**
Andreas-Gryphus-Strasse 20
D-51065 Köln (DE)
Erfinder: **Stetter, Jörg, Prof.Dr.**
Gellertweg 4
D-42115 Wuppertal (DE)
Erfinder: **Santel, Hans-Joachim, Dr.**
Grünstrasse 9A
D-51371 Leverkusen (DE)
Erfinder: **Dollinger, Markus, Dr.**
Burscheider Strasse 154b
D-51381 Leverkusen (DE)

(54) **N-Azinyl-N'-(het)arylsulfonylharnstoffe als Herbizide.**

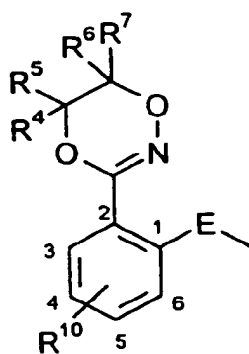
(57) Die Erfindung betrifft neue N-Azinyl-N'-(het)arylsulfonylharnstoffe der Formel (I),



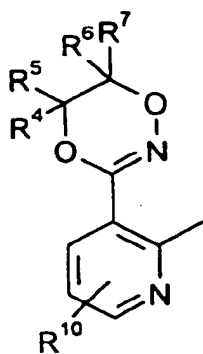
in welcher

J für J-1 bis J-4 steht, wobei J-1 bis J-4 folgende Bedeutungen haben:

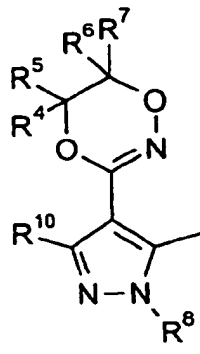
EP 0 645 386 A1



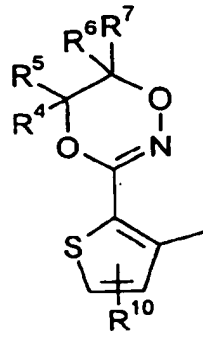
J-1



J-2



J-3



J-4

worin

E für eine direkte Bindung, Alkylen, Sauerstoff, Alkylamino oder Schwefel steht,
und in welcher

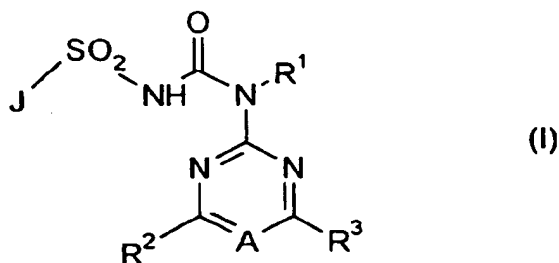
A für N oder CR¹¹ steht (wobei die Reste R¹-R¹¹ die in der Beschreibung genannten Bedeutungen haben),
mehrere Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Herbizide.

Die Erfindung betrifft neue N-Azinyl-N'-(het)arylsulfonyl-harnstoffe, Verfahren und neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte N-Alinyl-N'-arylsulfonylharnstoffe mit einfachen offenkettigen Hydroxamsäureester-Gruppen im Arylteil, wie z.B. N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-N'-(2-methoxyaminocarbonyl-phenylsulfonyl)-harnstoff und der entsprechende - N'-(2-n-octyloxyaminocarbonylphenylsulfonyl)-harnstoff herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. DE-A-3 516 435 \approx EP-A-173 958 \approx US-4 704 158). Die Herbizidwirkung dieser bekannten Verbindungen ist jedoch nicht in allen Belangen zufriedenstellend.

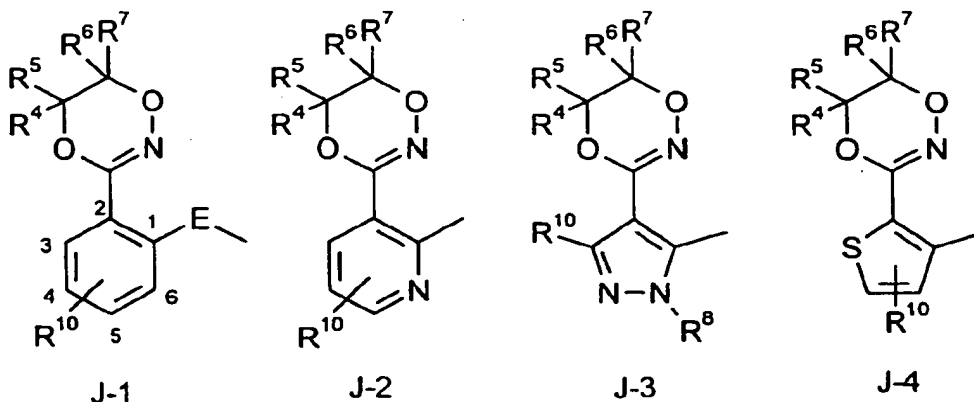
Weiterhin sind auch bestimmte herbizid wirksame N-Azinyl-N'-(het)arylsulfonylharnstoffe bekannt geworden, welche im (Het)arylteil durch O,O-dialkylierte, ebenfalls offenkettige Hydroxamsäure-Gruppen substituiert sind (vgl. EP-A-301 784); entsprechende cyclische Hydroxamsäurederivate sind dagegen bisher nicht beschrieben worden.

Es wurden nun neue N-Azinyl-N'-(het)arylsulfonyl-harnstoffe der allgemeinen Formel (I),



in welcher

- A für Stickstoff oder eine CR¹¹-Gruppierung steht, wobei
- R¹¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogen und Haloalkyl steht,
- 30 R¹ für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aralkyl und Aryl steht,
- R² für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- R³ für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl,
- 35 J für J-1 bis J-4 steht, wobei J-1 bis J-4 folgende Bedeutungen haben:



55 worin

- E für eine direkte Bindung, Alkyl, Sauerstoff, Alkylamino oder Schwefel steht,
- R⁴ - R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfo-

nyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen stehen,

R^8 für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl und Aryl oder für eine Gruppe $C(=O)R^9$ steht,

wobei
 R^9 für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl, Alkoxy, Alkylamino oder Dialkylamino steht,

R^{10} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht,

wobei in den vorgenannten Resten die Alkyl- und Alkylengruppen jeweils 1 bis 6 C-Atome, die Alkenyl- und Alkynylgruppen jeweils 2 bis 6 C-Atome, die Cycloalkylgruppen jeweils 3 bis 6 C-Atome und die Arylgruppen jeweils 6 bzw. 10 C-Atome enthalten können, sowie Salze von Verbindungen der Formel (I) gefunden.

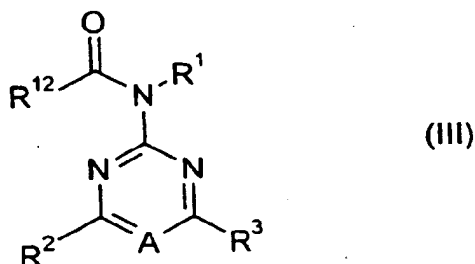
Charakteristisches Strukturmerkmal der neuen Sulfonylharnstoffe (I) ist demnach der (5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-Rest als neuartiger heterocyclischer Substituent im (Het)arylteil der N-Azinyln'- (het)-arylsulfonylharnstoffe. Der einfache, nicht weiter substituierte Grundkörper dieser Verbindungsklasse - das (5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzol, welches auch als 3-Phenyl-5H-1,4,2-dioxazin bezeichnet werden kann - ist bekannt (vgl. J.E. Johnson et al., J. Org. Chem., Vol. 36 (2), (1971), S. 284-294).

Man erhält die neuen N-Azinyln'- (het)arylsulfonylharnstoffe der allgemeinen Formel (I), wenn man
 (a) (Het)arylsulfonamide der allgemeinen Formel (II),



in welcher

J die oben angegebenen Bedeutungen hat, mit N-Azinyln'- (het)arylsulfonamiden der Formel (III),



in welcher

A und $R^1 - R^3$ die oben angegebenen Bedeutungen haben und
 R^{12} für Alkyl oder Aryl steht,

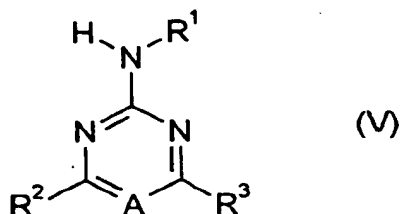
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt, oder wenn man

(b) (Het)arylsulfonylisocyanate der allgemeinen Formel (IV),



in welcher

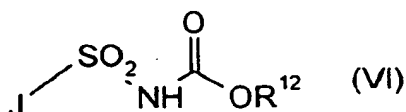
J die oben angegebenen Bedeutungen hat, mit Aminoazinen der Formel (V).



in welcher

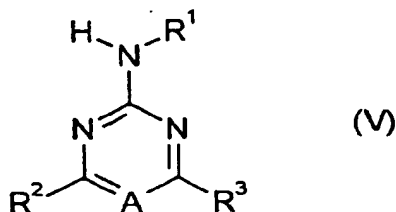
A und $\text{R}^1 - \text{R}^3$ die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt, oder wenn man

(c) N-(Het)arylsulfonylcarbamate der allgemeinen Formel (VI),



in welcher

J und R^{12} die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Aminoazinen der Formel (V),



in welcher

A und $\text{R}^1 - \text{R}^3$ die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt, und gegebenenfalls die nach Verfahren (a), (b) oder (c) erhaltenen Produkte nach üblichen Methoden in Salze überführt.

Die neuen N-Azinyln-(het)arylsulfonylharnstoffe der Formel (I) zeichnen sich durch starke herbizide Wirksamkeit aus.

Überraschenderweise zeigen die neuen Verbindungen der Formel (I) erheblich stärkere Wirkung als die nach Struktur und Wirkprofil vergleichbaren Verbindungen N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-N'-(2-methoxycarbonyl-phenylsulfonyl)-harnstoff und der entsprechende -N'-(2-n-octyloxyaminocarbonyl-phenylsulfonyl)-harnstoff.

Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise Verbindungen der Formel (I),
in welcher

A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,

R^1 für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls durch Halogen substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkenyl und Alkynyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen steht,

R^2 für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den

- Alkylresten steht,
 5 R^3 für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylresten steht,
 J für J-1 bis J-4 steht,
 E für eine direkte Bindung, Methylen, Sauerstoff, Alkylamino mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen oder Schwefel steht,
 10 $R^4 - R^7$ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl oder Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylresten steht,
 R^8 für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_7 - C_{11} -Aralkyl und C_6 - C_{10} -Aryl steht,
 15 R^{10} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl oder Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylresten steht.

Die Erfindung betrifft weiter vorzugsweise Salze, die man aus Verbindungen der Formel (I) und Basen, wie z.B. Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, -hydrid, -amid und -carbonat, Natrium- oder Kalium- C_1 - C_4 -alkanolaten, Ammoniak, C_1 - C_4 -Alkylaminen, Di-(C_1 - C_4 -alkyl)-aminen oder Tri-(C_1 - C_4 -alkyl)-aminen, nach
 20 üblichen Verfahren erhält.

Die Erfindung betrifft insbesondere Verbindungen der Formel (I),
 in welcher

- A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,
 25 R^1 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methoxymethyl oder Ethoxy steht,
 R^2 für Wasserstoff, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluoromethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluoromethoxy, Methylthio, Methylamino oder Dimethylamino steht,
 R^3 für Wasserstoff, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluoromethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluoromethoxy, Methylthio, Methylamino oder Dimethylamino steht,
 30 J für J-1 bis J-4 steht,
 E für eine direkte Bindung, Methylen, Sauerstoff, C_1 - C_2 -Alkylamino oder Schwefel steht,
 $R^4 - R^7$ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, oder für jeweils gegebenenfalls durch Chlor oder Fluor substituiertes Methyl, Methylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl steht,
 35 R^8 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Phenyl oder Benzyl steht,
 R^{10} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls durch Chlor oder Fluor substituiertes Methyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methyl- oder Dimethylamino steht.

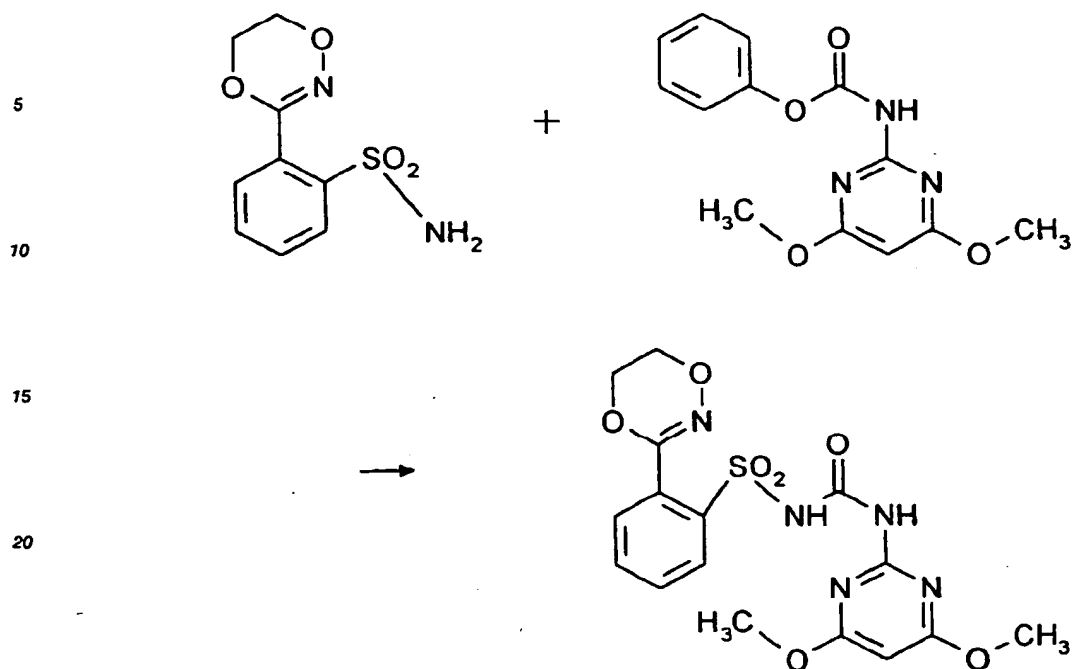
Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen gelten
 40 sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangs- bzw. Zwischenprodukte. Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.

Die bei den Restedefinitionen genannten Kohlenwasserstoffreste, wie Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl, auch in Kombinationen mit Heteroatomen, wie in Alkoxy, Alkylthio oder Alkylamino, sind auch dann, wenn dies nicht
 45 ausdrücklich angegeben ist, geradkettig oder verzweigt.

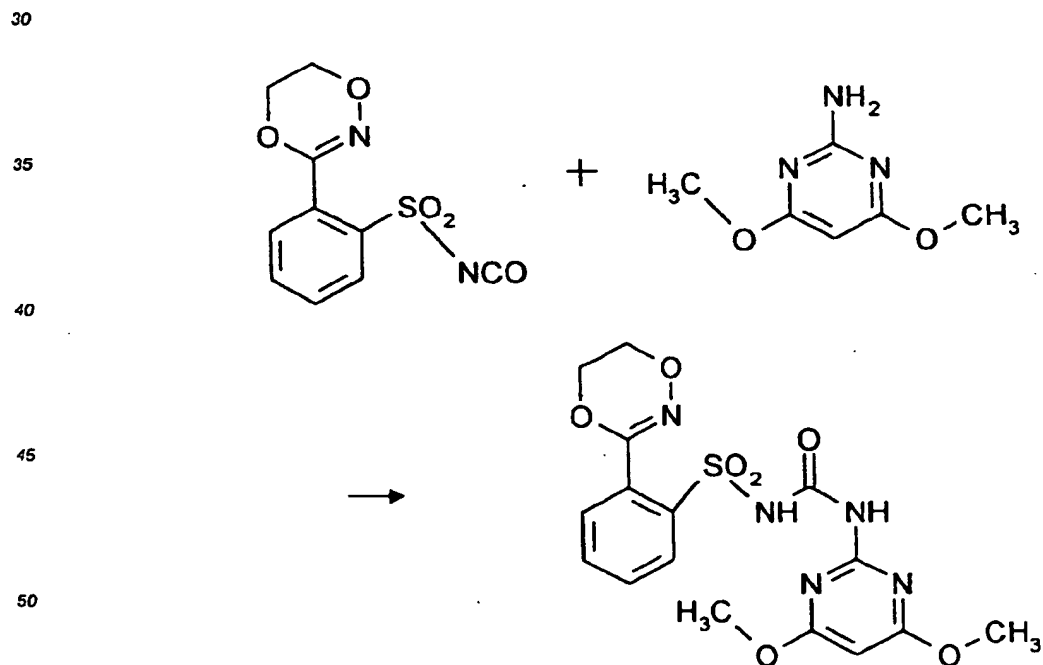
Verwendet man beispielsweise für die Verfahrensvariante (a) 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzolsulfonamid und (4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-phenylcarbammat als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsverlauf durch das folgende Formelschema skizziert werden:

50

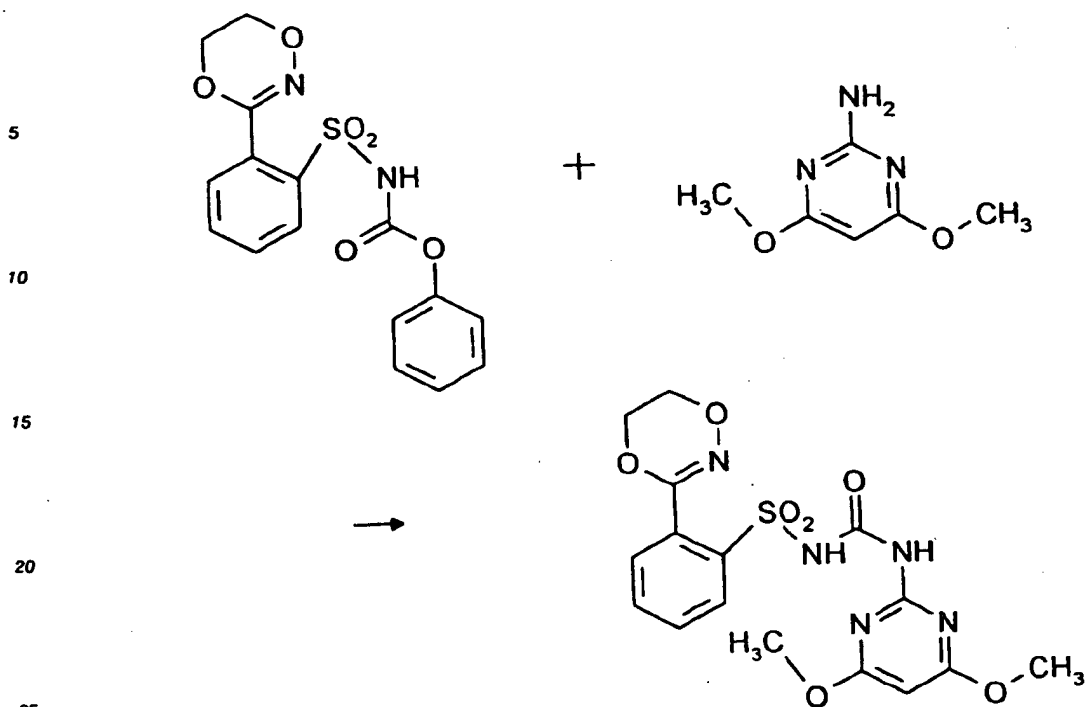
55



Verwendet man beispielsweise für die Verfahrensvariante (b) 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzolsulfonylisocyanat und 2-Amino-4,6-dimethoxypyrimidin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsverlauf durch das folgende Formelschema skizziert werden:



55 Verwendet man beispielsweise für die Verfahrensvariante (c) N-(2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzolsulfonyl)-phenylcarbamate und 2-Amino-4,6-dimethoxypyrimidin als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsverlauf durch das folgende Formelschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (a) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden (Het)arylsulfonamide sind durch Formel (II) allgemein definiert. In Formel (II) hat J vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für J angegeben wurden.

Als Beispiele für die Verbindungen der Formel (II) seien genannt:

2-(5,6-Dihydro[1,4,2]-dioxazin-3-yl)benzolsulfonamid, 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-6-methyl-benzolsulfonamid, 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-phenylmethansulfonamid, 3-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyridin-2-sulfonamid, 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)thiophen-3-sulfonamid, 1-Methyl-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyrazol-5-sulfonamid, 1-Methyl-3-chlor-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-pyrazol-5-sulfonamid.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind noch nicht aus der Literatur bekannt und sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (II) werden weiter unten beschrieben [vgl. Verfahren (d) und (e)].

Die bei Verfahren (a) außerdem als Ausgangsstoffe zu verwendenden N-Azinyldicarbamate sind durch Formel (III) allgemein definiert. In Formel (III) haben A, R¹, R² und R³ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für A, R¹, R² bzw. R³ angegeben wurden. R^{1,2} steht vorzugsweise für C₁-C₆-Alkyl oder C₆-C₁₀-Aryl, besonders bevorzugt für C₁-C₄-Alkyl oder Phenyl.

Als Beispiele für die Zwischenprodukte der Formel (III) seien genannt:

N-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4,6-Diethoxypyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-Methyl-N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-Methoxymethyl-N-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4,6-Diethylpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-[4,6-Bis(difluormethoxy)pyrimidin-2-yl]-phenylcarbamate, N-[4,6-Bis(dimethylamino)pyrimidin-2-yl]-phenylcarbamate, N-(4-Methyl-6-ethylpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methoxy-6-chlorpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Ethoxy-6-methylaminotriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methoxy-6-methyltriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Isopropoxy-6-chlortriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methoxy-6-chlortriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Trifluoromethyl-6-methoxytriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-[4-(2,2,2-Trifluoroethoxy)-6-dimethylaminotriazin-2-yl]-phenylcarbamate, N-(4-Methylamino-6-chlortriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methoxy-6-di-

methylaminotriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4,6-Dimethoxytriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4,6-Diethoxytriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4,6-Dimethyltriazin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methyl-6-chlorpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methoxy-6-ethoxypyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methoxy-6-dimethylaminopyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Ethoxy-6-chlorpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Methyl-6-dimethylaminopyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Ethoxy-6-isopropoxypyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Dimethylamino-6-chlorpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-[4-(2,2,2-Trifluoroethoxy)-6-chlorpyrimidin-2-yl]-phenylcarbamate, N-(4-Methylamino-6-chlorpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-(4-Difluoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate, N-[4-(2,2,2-Trifluoroethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)-phenylcarbamate.

Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-238 070).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden (Het)arylsulfonylisocyanate sind durch Formel (IV) allgemein definiert. In Formel (IV) hat J vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für J angegeben wurden.

Als Beispiele für die Ausgangsstoffe der Formel (IV) seien genannt:

2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)benzolsulfonylisocyanat, 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-6-methylbenzolsulfonylisocyanat, 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)phenylmethansulfonylisocyanat, 3-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyridin-2-sulfonylisocyanat, 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)thiophen-3-sulfonylisocyanat, 1-Methyl-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyrazol-5-sulfonylisocyanat, 1-Methyl-3-chlor-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyrazol-5-sulfonylisocyanat.

Die Ausgangsstoffe der Formel (IV) sind noch nicht aus der Literatur bekannt und sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

Man erhält die neuen (Het)arylsulfonylisocyanate der Formel (IV), wenn man (Het)arylsulfonamide der obigen Formel (II) mit Phosgen in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Chlorbenzol, und von Reaktionshilfsmitteln, wie z.B. Butylisocyanat und Diazabicyclooctan (DABCO), bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 20°C und 160°C, umsetzt und anschließend die flüchtigen Komponenten unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert (vgl. EP-162 723).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (b) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe benötigten Aminoazine sind durch Formel (V) allgemein definiert. In Formel (V) haben A, R¹, R² und R³ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R¹, R² und R³ angegeben wurden.

Als Beispiele für die Ausgangsstoffe der Formel (V) seien genannt:

2-Amino-4,6-dimethoxypyrimidin, 2-Amino-4,6-diethoxypyrimidin, 2-Methylamino-4,6-dimethoxypyrimidin, 2-Methoxymethylamino-4,6-dimethoxypyrimidin, 2-Amino-4,6-dimethylpyrimidin, 2-Amino-4,6-diethylpyrimidin, 2-Amino-4,6-bis(difluormethoxy)pyrimidin, 2-Amino-4,6-bis(dimethylamino)pyrimidin, 2-Amino-4-methyl-6-ethylpyrimidin, 2-Amino-4-methoxy-6-chlorpyrimidin, 2-Amino-4-ethoxy-6-methylaminotriazin, 2-Amino-4-methoxy-6-methyltriazin, 2-Amino-4-isopropoxy-6-chlortriazin, 2-Amino-4-methoxy-6-chlortriazin, 2-Amino-4-(2,2,2-trifluoroethoxy)-6-dimethylaminotriazin, 2-Amino-4-trifluormethyl-6-methoxytriazin, 2-Amino-4-methylamino-6-chlortriazin, 2-Amino-4-methoxy-6-dimethylaminotriazin, 2-Amino-4,6-dimethoxytriazin, 2-Amino-4,6-diethoxytriazin, 2-Amino-4,6-dimethyltriazin, 2-Amino-4-methyl-6-chlorpyrimidin, 2-Amino-4-methoxy-6-methylpyrimidin, 2-Amino-4-methoxy-6-ethoxypyrimidin, 2-Amino-4-methoxy-6-dimethylaminopyrimidin, 2-Amino-4-ethoxy-6-chlorpyrimidin, 2-Amino-4-ethoxy-6-dimethylaminopyrimidin, 2-Amino-4-methyl-6-dimethylaminopyrimidin, 2-Amino-4-methyl-6-isopropoxypyrimidin, 2-Amino-4-dimethylamino-6-chlorpyrimidin, 2-Amino-4-(2,2,2-trifluoroethoxy)-6-chlorpyrimidin, 2-Amino-4-methylamino-6-chlorpyrimidin, 2-Amino-4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin, 2-Amino-4-(2,2,2-trifluoroethoxy)-6-methylpyrimidin.

Die Ausgangsstoffe der Formel (V) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. Huaxue Shijie, 32(6), 254-7 (1991); JP-01 016 770; EP-246 984); zum Teil sind diese Stoffe im Handel erhältliche Syntheschemikalien.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden (Het)arylsulfonylcarbamate sind durch Formel (VI) allgemein definiert. In Formel (VI) haben J und R¹² vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formeln (I) bzw. (III) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für J bzw. R¹² angegeben wurden.

Als Beispiele für die Ausgangsstoffe der Formel (VI) seien genannt:

N-(2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)benzolsulfonyl)-phenylcarbamate, N-(2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-

yl)-6-methyl-benzolsulfonyl)-phenylcarbamate, N-(2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)phenylmethansulfonyl)-phenylcarbamate, N-(3-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyridin-2-sulfonyl)-phenylcarbamate, N-(2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)thiophen-3-sulfonyl)-phenylcarbamate, N-(1-Methyl-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyrazol-5-sulfonyl)-phenylcarbamate, N-(1-Methyl-3-chlor-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyrazol-5-sulfonyl)-phenylcarbamate.

Die Ausgangsstoffe der Formel (VI) sind noch nicht aus der Literatur bekannt und sind als neue Stoffe auch Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

Man erhält die neuen (Het)arylsulfonylcarbamate der Formel (VI), wenn man (Het)arylsulfonamide der obigen Formel (II) mit Chlorameisensäureester in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie z.B. Dioxan oder Acetonitril, und von Reaktionshilfsmitteln, wie z.B. Pyridin, Kalium- oder Calciumcarbonat, bei Temperaturen zwischen 0°C und 120°C, vorzugsweise zwischen 20°C und 100°C, umsetzt und anschließend die wichtigsten Komponenten unter vermindertem Druck sorgfältig abdestilliert (vgl. JP-04139170).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (c) weiter als Ausgangsstoffe benötigten Aminoazine der Formel (V) sind bereits oben bei Verfahren (b) näher beschrieben worden.

Die neuen, oben beschriebenen und nahe miteinander verwandten Ausgangs- bzw. Zwischenprodukte der Formeln (II), (IV) und (VI) können zusammenfassend als "(Het)arylsulfonylverbindungen" bezeichnet und durch folgende Formel (XI) dargestellt werden:



in welcher

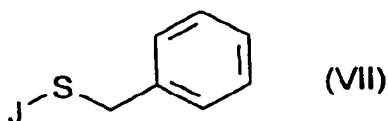
J die oben bei Formel (I) genannten Bedeutungen hat und

G für -NH_2 , $\text{-N}=\text{C}=\text{O}$ oder -NH-COOR^{12} steht, wobei R^{12} die oben angegebene Bedeutung hat.

Es wurde weiterhin gefunden, daß man die oben beschriebenen (Het)arylsulfonamide der Formel (II) erhält,

wenn man

(d) (Het)arylthiobenzylether der Formel (VII),

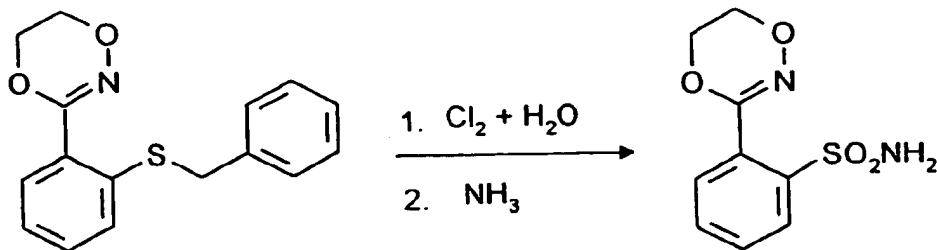


in welcher

J die oben bei Formel (I) genannten Bedeutungen hat,

mit einem Chlorierungsmittel und Wasser in Gegenwart eines inerten organischen Verdünnungsmittels und gegebenenfalls eines Reaktionshilfsmittels umsetzt und die so erhaltenen Sulfonylchloride mit Ammoniak oder einem Ammoniumsalz in Gegenwart eines inerten organischen Verdünnungsmittels und gegebenenfalls eines Reaktionshilfsmittels umsetzt (vgl. EP-232 067, EP-451 468, US-5 157 119).

Verwendet man beispielsweise für das Verfahren (d) 1-Benzylthio-2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)benzol, Chlor, Wasser und Ammoniak als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsverlauf durch das folgende Reaktionsschema skizziert werden:



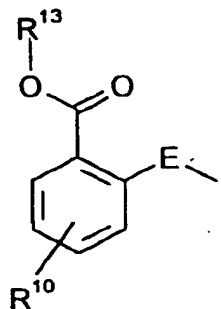
(e) Alternativ erhält man die neuen (Het)arylsulfonamide der Formel (II), wenn man (Het)arylsulfonamide der Formel (VIII),

T-SO₂NH₂ (VIII)

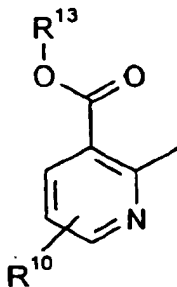
in welcher

T für T-1 bis T-4 steht,
wobei

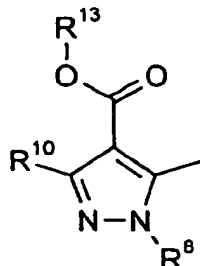
T-1 bis T-4 folgende Bedeutungen haben:



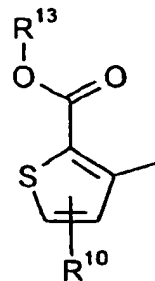
T-1



T-2



T-3



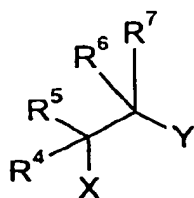
T-4

worin

E, R⁸ und R¹⁰

R¹³

die oben angegebenen Bedeutungen haben und
für Alkyl oder Aryl, vorzugsweise für C₁-C₄-Alkyl oder Phenyl steht,
mit Hydroxylamin-Hydrochlorid und einem substituierten Alkan der Formel (IX),



(IX)

in der

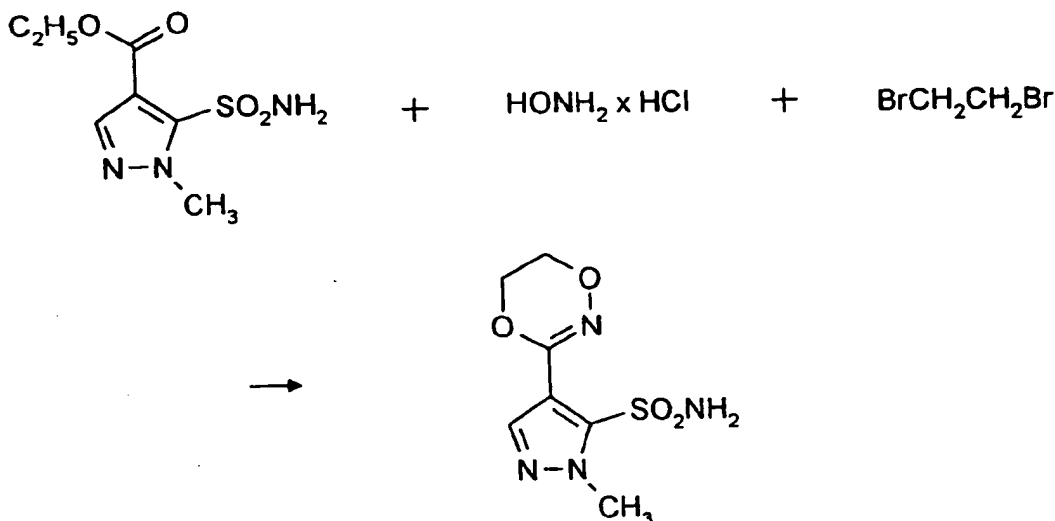
R⁴ - R⁷

X und Y

die oben angegebenen Bedeutungen haben und
unabhängig voneinander für Halogen, gegebenenfalls substituiertes Alkyl- oder Arylcarbo-
nyloxy oder -sulfonyloxy (vorzugsweise für Chlor, Brom, Iod, C₁-C₆-Alkyl oder C₆-C₁₂-
Arylcarbo-nyloxy oder -sulfonyloxy) stehen,

gegebenenfalls in Gegenwart eines organischen Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart
eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt (vgl. J. Org. Chem., Vol. 36(2), S. 284-294(1971); JP-01 221 371).

Verwendet man beispielsweise für das Verfahren (e) 1-Methyl-4-ethoxycarbonylpyrazol-5-sulfonamid,
Hydroxylamin-Hydrochlorid und 1,2-Dibromethan als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsverlauf durch
das folgende Reaktionsschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (d) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (II) als Ausgangsstoffe benötigten (Het)arylthiobenzylether sind durch Formel (VII) allgemein definiert. In Formel (VII) hat J vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für J angegeben wurden.

Als Beispiele für die Zwischenprodukte der Formel (VII) seien genannt: 1-Benzylthio-2-(5,6-dihydro-[1,2,4]-dioxazin-3-yl)-benzol, 1-Benzylthio-2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-6-methyl-benzol, 1-Benzylthiomethyl-2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)benzol, 2-Benzylthio-3-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-pyridin, 1-Methyl-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-5-benzylthio-pyrazol, 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-3-benzylthio-thiophen, 1-Methyl-3-chlor-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-5-benzylthio-pyrazol.

Die Ausgangsstoffe der Formel (VII) sind noch nicht aus der Literatur bekannt und sind als neue Stoffe ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

Ein Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VII) wird weiter unten beschrieben (vgl. Verfahren (f)).

Als Beispiele für die bei Verfahren (d) außerdem als Ausgangsstoffe zu verwendenden Chlorierungsmittel seien genannt: Chlor, Sulfurylchlorid, Alkalihypochlorit, Chlorsulfonsäure.

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (e) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (II) als Ausgangsstoffe zu verwendenden (Het)arylsulfonamide sind durch Formel (VIII) allgemein definiert. In der Formel (VIII) hat die Gruppe T diejenigen bevorzugten Bedeutungen, die sich aus den obigen Definitionen der darin enthaltenen Reste E, R⁸, R¹⁰ bzw. R¹³ ergeben.

Als Beispiele für die Zwischenprodukte der Formel (VIII) seien genannt: 1-Methyl-4-ethoxycarbonylpyrazol-5-sulfonamid, 1-Methyl-3-chlor-4-ethoxycarbonylpyrazol-5-sulfonamid, 2-Methoxycarbonylbenzolsulfonamid, (2-Methoxycarbonylphenyl)methansulfonamid, 3-Methoxycarbonylpyridin-2-sulfonamid, 2-Methoxycarbonylthiophen-3-sulfonamid.

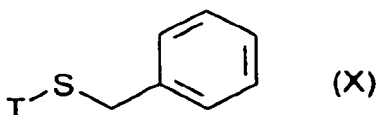
Die Ausgangsstoffe der Formel (VIII) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. z.B. J. Heterocycl. Chem., 28(8), 1849-52 (1991); Pestic. Sci., 32(1), 91-104 (1991); Nippon Noyaku Gakkaishi, 15(4), 531-8 (1990); JP-63 051 394, JP-61 210 003; Eur. J. Med. Chem., 23(4), 329-34 (1988); ES-547 444, DE-2 706 859, DE-2 534 689).

Bei bei Verfahren (e) weiterhin als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Alkane sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In Formel (IX) haben die Substituenten R⁴, R⁵, R⁶ und R⁷ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R⁴-R⁷ angegeben wurden; die reaktiven, vicinalen Abgangsgruppen X und Y haben die bereits bei Formel (IX) angegebenen bevorzugten Bedeutungen.

Als Beispiele für besonders geeignete Verbindungen der Formel (IX) seien genannt: 1,2-Dichlorethan, 1,2-Dibromethan, 1,2-Diodethan, 1,2-Bis-(methansulfonyloxy)ethan, 1,2-Bis-(trifluormethansulfonyloxy)ethan, 1,2-Bis-(trifluoracetyloxy)-ethan, 1,2-Bis-(4-toluolsulfonyloxy)ethan.

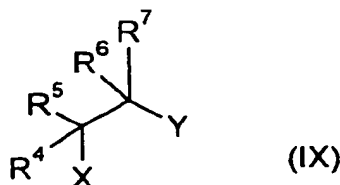
Die Ausgangsstoffe der Formel (IX) sind durchweg bekannte, zum Teil im Handel erhältliche Synthesesechemikalien.

Schließlich wurde gefunden, daß man die neuen, für Verfahren (d) benötigten (Het)-arylthiobenzylether der obigen Formel (VII) erhält, wenn man
(f) (Het)arylthiobenzylcarbonsäureester der Formel (X)



in welcher

T die oben bei Verfahren (e) angegebenen Bedeutungen hat,
mit Hydroxylamin-Hydrochlorid und einem substituierten Alkan der Formel (IX),

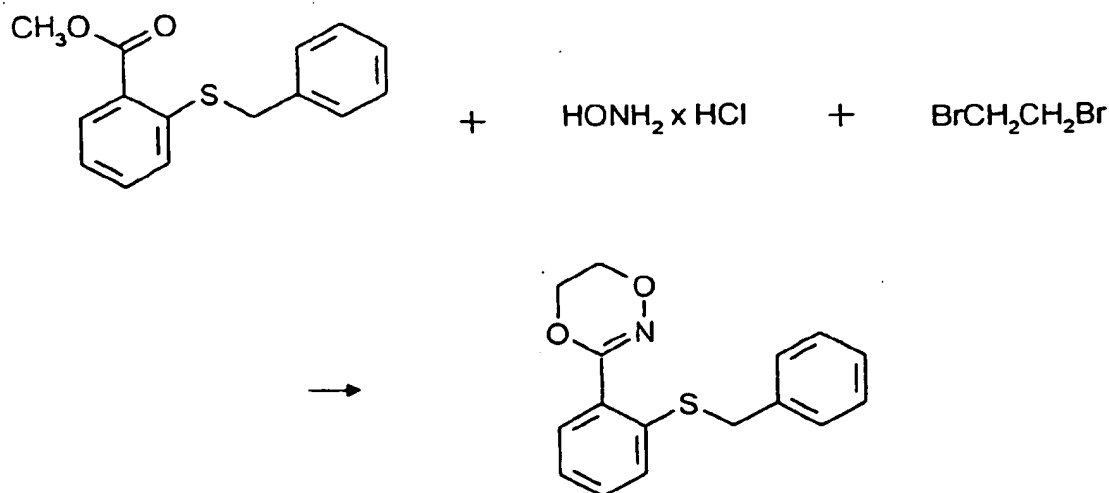


in der

R⁴ - R⁷ die oben angegebenen Bedeutungen haben und
X und Y unabhängig voneinander für Halogen, gegebenenfalls substituiertes Alkyl- oder Arylcarbo-
nyloxy oder -sulfonyloxy (vorzugsweise für Chlor, Brom, Iod, C₁-C₆-Alkyl- oder C₆-C₁₂-
Arylcarbo-nyloxy oder -sulfonyloxy) stehen,

gegebenenfalls in Gegenwart eines organischen Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt.

Verwendet man beispielsweise für das Verfahren (f) 2-Benzylmercaptobenzoessäuremethylester, Hydroxylamin-Hydrochlorid und 1,2-Dibromethan als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsverlauf durch das folgende Reaktionsschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren (f) zur Herstellung von Verbindungen der Formel (VII) als Ausgangsstoffe benötigten (Het)arylthiobenzylcarbonsäureester sind durch Formel (X) allgemein definiert; für die Bedeutung der Gruppe T gilt das oben bei Verfahren (e) dazu Gesagte.

Als Beispiele für die Zwischenprodukte der Formel (X) seien genannt: 2-Benzylmercaptobenzoessäuremethylester, 2-Benzylmercapto-6-methyl-benzoessäuremethylester, (2-Benzylmercaptophenyl)-essigsäuremethylester, 2-Benzylmercaptopyridin-3-carbonsäuremethylester, 1-Methyl-5-benzylmercaptopyrazol-4-carbonsäuremethylester, 1-Methyl-3-chlor-5-benzylmercaptopyrazol-4-carbonsäuremethylester, 3-Benzylmercaptothiophen-2-carbonsäuremethylester.

Die Ausgangsstoffe der Formel (X) sind bekannt und/oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. z.B. Chem. Pharm. Bull., 34(2), 540-9 (1986), J. Heterocycl. Chem. 15(3), 513-14 (1978)).

Die bei Verfahren (f) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten Alkane der Formel (IX) sind bereits oben bei Verfahren (e) näher beschrieben worden.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) zur Herstellung der neuen Verbindungen (I), die erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) zur Herstellung der neuen Zwischenprodukte der Formel (II) sowie das erfindungsgemäße Verfahren (f) zur Herstellung der neuen Zwischenprodukte der Formel (VII) werden vorzugsweise unter Verwendung von Verdünnungsmitteln durchgeführt. Als Verdünnungsmittel kommen dabei praktisch alle inerten organischen Lösungsmittel infrage. Hierzu gehören vorzugsweise - außer für Verfahren (d) - aliphatische und aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Petrolether, Benzin, Ligroin, Benzol, Toluol, Xylol, Methylenchlorid, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, Ether wie Diethyl- und Dibutylether, Glykoldimethylether und Diglycoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, Ketone wie Aceton, Methyl-ethyl-, Methyl-isopropyl- und Methylisobutyl-keton, Ester wie Essigsäuremethylester und -ethylester, Nitrile wie z.B. Acetonitril und Propionitril, Amide wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylacetamid und N-Methylpyrrolidon sowie Dimethylsulfoxid, Tetramethylsulfon und Hexamethylphosphorsäuretriämid.

Für das Chlorierungsverfahren (d) kommen als Verdünnungsmittel hauptsächlich nur die vorerwähnten chlorierten Lösungsmittel in Betracht.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (e) und (f) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Hierzu gehören vorzugsweise basische organische Stickstoffverbindungen, wie z.B. Trimethylamin, Triethylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, 4-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) und Diazabicycloundecen (DBU), sowie anorganische Basen, wie z.B. Natriumhydrid, Kaliumhydrid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Calciumcarbonat, Kaliumhydroxid, Natriumhydroxid, und Calciumhydroxid.

Auch die erfindungsgemäßen Verfahren (b) und (c) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Hierfür geeignet sind vorzugsweise basische organische Stickstoffverbindungen, wie z.B. Trimethylamin, Triethylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, 4-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) und Diazabicycloundecen (DBU).

Das Chlorierungsverfahren (d) kann ebenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt werden. Besonders geeignet hierfür sind bestimmte mineralische und organische Säuren, wie z.B. Salzsäure, verdünnte Schwefelsäure, Phosphorsäure, Essigsäure oder Propionsäure, ferner saure Salze wie z.B. NaH_2PO_4 .

Die Reaktionstemperaturen können bei den Verfahren (a) bis (f) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. So arbeitet man

- bei Verfahren (a) im allgemeinen bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 10°C und 80°C;
- bei Verfahren (b) im allgemeinen bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 20°C und 100°C;
- bei Verfahren (c) im allgemeinen ebenfalls bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 20°C und 100°C;
- bei Verfahren (d) im allgemeinen bei Temperaturen zwischen -20°C und +40°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen -20°C und +30°C;
- bei Verfahren (e) im allgemeinen bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 10°C und 80°C und
- bei Verfahren (f) im allgemeinen gleichfalls bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 10°C und 80°C.

Die Verfahren (a) bis (f) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch jeweils auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) bis (f) werden die jeweils benötigten Ausgangsstoffe in annähernd äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der beiden jeweils eingesetzten Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Reaktionen werden im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel und gegebenenfalls unter Zusatz eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt, und das Reaktionsgemisch wird mehrere Stunden bei der jeweils erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung erfolgt bei den erfindungsgemäßen Verfahren jeweils nach üblichen Methoden.

Aus den erfindungsgemäßen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können gegebenenfalls Salze hergestellt werden. Man erhält solche Salze in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, beispielsweise durch Lösen oder Dispergieren einer Verbindung der Formel (I) in einem geeigneten Verdünnungsmittel, wie z.B. Methylenchlorid, Aceton, tert.-Butyl-methylether oder Toluol, und Zugabe einer geeigneten Base. Die Salze können dann - gegebenenfalls nach längerem Rühren - durch Einengen oder Absaugen isoliert werden (vgl. die Herstellbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defolianten, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst-, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Zitrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eignen sich zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in verschiedenen Kulturen, teilweise z.B. in Weizen, sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel könne z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene, oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quartz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate; als feste Trägerstoffe für

Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nicht ionogene und anionische Emulgatoren, wie

5 Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Ligninsulfitaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische, pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol,

10 Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

20 Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise Anilide, wie z.B. Diflufenican und Propanil; Arylcarbonsäuren, wie z.B. Dichlorpicolinsäure, Dicamba und Picloram; Aryloxyalkansäuren, wie z.B. 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Fluroxypyr, MCPA, MCPP und Triclopyr; Aryloxy-phenoxy-alkansäureester, wie z.B. Diclofop-methyl, Fenoxaprop-ethyl, Fluazifop-butyl, Haloxyfop-methyl und Quizalofop-ethyl, Azino-

25 ne, wie z.B. Chloridazon und Norflurazon; Carbamate, wie z.B. Chlorpropham, Desmedipham, Phenmedipham und Propham; Chloracetanilide, wie z.B. Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor, Metolachlor, Pretilachlor und Propachlor; Dinitroaniline, wie z.B. Oryzalin, Pendimethalin und Trifluralin; Diphenylether, wie z.B. Acifluorfen, Bifenox, Fluoroglycofen, Fomesafen, Halosafen, Lactofen und Oxyfluorfen; Harnstoffe, wie z.B. Chlortoluron, Diuron, Fluometuron, Isoproturon, Linuron und Methabenzthiazuron; Hydroxylamine, wie z.B. Alloxidim, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim und Tralkoxydim; Imidazolinone, wie z.B. Imazetha-

30 pyr, Imazamethabenz, Imazapyr und Imazaquin; Nitrile, wie z.B. Bromoxynil, Dichlobenil und Ioxynil; Oxyacetamide, wie z.B. Mefenacet; Sulfonylharnstoffe, wie z.B. Amidosulfuron, Bensulfuron-methyl, Chlormuronethyl, Chlorsulfuron, Cinosulfuron, Metsulfuron-methyl, Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron-ethyl, Thifensulfuron-methyl, Triasulfuron und Tribenuron-methyl; Thiolcarbamate, wie z.B. Butylate, Cycloate, Diallate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb und Triallate; Triazine, wie z.B. Atrazin,

35 Cyanazin, Simazin, Simetryne, Terbutryne und Terbutylazin; Triazinone, wie z.B. Hexazinon, Metamitron und Metribuzin; Sonstige, wie z.B. Aminotriazol, Benfuresate, Bentazone, Cinmethylin, Clomazone, Clopyralid, Difenzoquat, Dithiopyr, Ethofumesate, Fluorochloridone, Glufosinate, Glyphosate, Isoxaben, Pyridate, Quinchlorac, Quinmerac, Sulphosate und Tridiphane.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden,

40 Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch

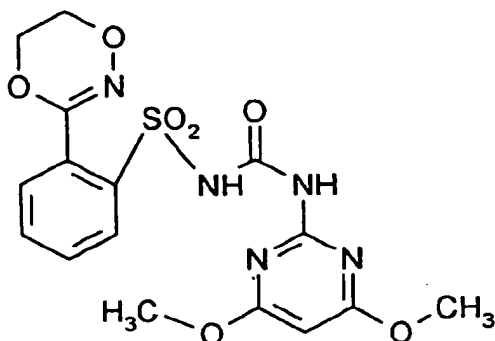
45 Gießen, Spritzen; Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 10 g

50 und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 50 g und 5 kg pro Hektar.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele:Beispiel I-1

(Verfahren (a))

Zu einer Mischung von 4.0 g (0.017 Mol) 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)benzolsulfonamid und 4.6 g (0.017 Mol) 2-Phenoxycarbonylamino-4,6-dimethoxypyrimidin in 20 ml absolutem Acetonitril gibt man unter Argon 0.79 g (0.033 Mol) Natriumhydrid und rührt 18 Stunden bei Raumtemperatur. Der Niederschlag wird abgesaugt und mit 20-prozentiger Natriumdihydrogenphosphatlösung verrührt. Der Niederschlag wird abgesaugt und im Hochvakuum getrocknet. Man erhält 3.9 g (56% der Theorie) N-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-N'-(2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)benzolsulfonyl)-harnstoff vom Schmelzpunkt 189° C.

Analog Beispiel I-1 und entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellungsverfahren können beispielsweise auch die weiteren, in den nachstehenden Tabellen 1, 2, 3 und 4 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) hergestellt werden.

Abkürzungen:

Smp.: = Schmelzpunkt

Zers. oder Z. = unter Zersetzung

(*) = Der angegebene Schmelzpunkt (Smp.) bezieht sich jeweils auf das entsprechende Natriumsalz.

Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I) mit
 $R^4 = R^5 = R^6 = R^7 = H$; $R^8 = CH_3$ und $R^{10} = H$:

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-1	J-1	-	H	CH	OCH ₃	OCH ₃	224 163 ⁽⁺⁾
I-2	J-1	-	H	CH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	176 70-71 ⁽⁺⁾
I-3	J-1	-	H	CH	OCH ₃	CH ₃	145-146 157-163 ⁽⁺⁾
I-4	J-1	-	H	CH	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-5	J-1	-	H	CH	OCH ₃	CF ₃	
I-6	J-1	-	H	CH	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-7	J-1	-	H	CH	OCH ₃	NHCH ₃	
I-8	J-1	-	H	CH	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	192-193
I-9	J-1	-	H	CH	OCH ₃	Cl	100-103 172-174 ⁽⁺⁾
I-10	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	162
I-11	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-12	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-13	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-14	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-15	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	I-16	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
	I-17	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	Cl	119-122
	I-18	J-1	H	CH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	186-187 172-173(*)
10	I-19	J-1	-	H	CH	CH ₃	C ₂ H ₅	
	I-20	J-1	-	H	CH	CH ₃	CF ₃	
	I-21	J-1	-	H	CH	CH ₃	OCF ₂ H	
	I-22	J-1	-	H	CH	CH ₃	NHCH ₃	
15	I-23	J-1	-	H	CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂	133 99 (*)
	I-24	J-1	-	H	CH	CH ₃	Cl	146 110-111(*)
20	I-25	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-26	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-26	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	CF ₃	
25	I-27	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
	I-28	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-29	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	Cl	
	I-30	J-1	-	H	CH	CF ₃	CF ₃	
30	I-31	J-1	-	H	CH	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-32	J-1	-	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
	I-33	J-1	-	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
35	I-34	J-1	-	H	CH	CF ₃	Cl	
	I-35	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
	I-36	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	NHCH ₃	
	I-37	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
40	I-38	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	Cl	
	I-39	J-1	-	H	CH	NHCH ₃	NHCH ₃	
	I-40	J-1	-	H	CH	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
45	I-41	J-1	-	H	CH	NHCH ₃	Cl	
	I-42	J-1	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
	I-43	J-1	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	
50	I-44	J-1	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-45	J-1	-	H	N	OCH ₃	OCH ₃	193 (Z.)
I-46	J-1	-	H	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-47	J-1	-	H	N	OCH ₃	CH ₃	190-192 178 (*)
I-48	J-1	-	H	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-49	J-1	-	H	N	OCH ₃	CF ₃	
I-50	J-1	-	H	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-51	J-1	-	H	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-52	J-1	-	H	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	91-93 175 (*)
I-53	J-1	-	H	N	OCH ₃	Cl	
I-54	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-55	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-56	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-57	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-58	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-59	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-60	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-61	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-62	J-1	-	H	N	CH ₃	CH ₃	179-181 168-172(*)
I-63	J-1	-	H	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-64	J-1	-	H	N	CH ₃	CF ₃	
I-65	J-1	-	H	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

I-66	J-1	-	H	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-67	J-1	-	H	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-68	J-1	-	H	N	CH ₃	Cl	
I-69	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-70	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-71	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-72	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-73	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-74	J-1	-	H	N	CF ₃	CF ₃	
I-75	J-1	-	H	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-76	J-1	-	H	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-77	J-1	-	H	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-78	J-1	-	H	N	CF ₃	Cl	
I-79	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-80	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-81	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-82	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	Cl	
I-83	J-1	-	H	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-84	J-1	-	H	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-85	J-1	-	H	N	NHCH ₃	Cl	
I-86	J-1	-	H	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-87	J-1	-	H	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-88	J-1	-	H	N	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-89	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	151-152 ^(*)
I-90	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-91	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	CH ₃	
I-92	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-93	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	CF ₃	
I-94	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-95	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-96	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-97	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	Cl	
I-98	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-99	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-100	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-101	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-102	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-103	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-104	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-105	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-106	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	CH ₃	
I-107	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-108	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	CF ₃	
I-109	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

5	I-110	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	NHCH ₃	
	I-111	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-112	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	Cl	
10	I-113	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-114	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
	I-115	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
15	I-116	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-117	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	Cl	
	I-118	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	CF ₃	
20	I-119	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-120	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	NHCH ₃	
	I-121	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
25	I-122	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	Cl	
	I-123	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
	I-124	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
30	I-125	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
	I-126	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	Cl	
35	I-127	J-1	-	CH ₃	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
	I-128	J-1	-	CH ₃	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-129	J-1	-	CH ₃	N	NHCH ₃	Cl	
40	I-130	J-1	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
	I-131	J-1	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
	I-132	J-1	-	CH ₃	N	Cl	Cl	

45

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung) :

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-133	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	OCH ₃	
I-134	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-135	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	CH ₃	
I-136	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-137	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	CF ₃	
I-138	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-139	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	NHCH ₃	
I-140	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-141	J-1	CH ₂	H	CH	OCH ₃	Cl	
I-142	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-143	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-144	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-145	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-146	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-147	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-148	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-149	J-1	CH ₂	H	CH	OC ₂ H ₅	Cl	
I-150	J-1	CH ₂	H	CH	CH ₃	CH ₃	
I-151	J-1	CH ₂	H	CH	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-152	J-1	CH ₂	H	CH	CH ₃	CF ₃	
I-153	J-1	CH ₂	H	CH	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

I-154	J-1	CH ₂	H	CH	CH ₃	NHCH ₃	
I-155	J-1	CH ₂	H	CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-156	J-1	CH ₂	H	CH	CH ₃	Cl	
I-157	J-1	CH ₂	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-158	J-1	CH ₂	H	CH	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-159	J-1	CH ₂	H	CH	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-160	J-1	CH ₂	H	CH	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-161	J-1	CH ₂	H	CH	C ₂ H ₅	Cl	
I-162	J-1	CH ₂	H	CH	CF ₃	CF ₃	
I-163	J-1	CH ₂	H	CH	CF ₃	OCF ₂ H	
I-164	J-1	CH ₂	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
I-165	J-1	CH ₂	H	CH	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-166	J-1	CH ₂	H	CH	CF ₃	Cl	
I-167	J-1	CH ₂	H	CH	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-168	J-1	CH ₂	H	CH	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-169	J-1	CH ₂	H	CH	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-170	J-1	CH ₂	H	CH	OCF ₂ H	Cl	
I-171	J-1	CH ₂	H	CH	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-172	J-1	CH ₂	H	CH	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-173	J-1	CH ₂	H	CH	NHCH ₃	Cl	
I-174	J-1	CH ₂	H	CH	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-175	J-1	CH ₂	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-176	J-1	CH ₂	H	CH	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung) :

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-177	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	OCH ₃	
I-178	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-179	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	CH ₃	
I-180	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-181	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	CF ₃	
I-182	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-183	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-184	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-185	J-1	CH ₂	H	N	OCH ₃	Cl	
I-186	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-187	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-188	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-189	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-190	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-191	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-192	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-193	J-1	CH ₂	H	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-194	J-1	CH ₂	H	N	CH ₃	CH ₃	
I-195	J-1	CH ₂	H	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-196	J-1	CH ₂	H	N	CH ₃	CF ₃	
I-197	J-1	CH ₂	H	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

5	I-198	J-1	CH ₂	H	N	CH ₃	NHCH ₃	
	I-199	J-1	CH ₂	H	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-200	J-1	CH ₂	H	N	CH ₃	Cl	
10	I-201	J-1	CH ₂	H	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-202	J-1	CH ₂	H	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
	I-203	J-1	CH ₂	H	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
15	I-204	J-1	CH ₂	H	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-205	J-1	CH ₂	H	N	C ₂ H ₅	Cl	
	I-206	J-1	CH ₂	H	N	CF ₃	CF ₃	
20	I-207	J-1	CH ₂	H	N	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-208	J-1	CH ₂	H	N	CF ₃	NHCH ₃	
	I-209	J-1	CH ₂	H	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
25	I-210	J-1	CH ₂	H	N	CF ₃	Cl	
	I-211	J-1	CH ₂	H	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
	I-212	J-1	CH ₂	H	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
30	I-213	J-1	CH ₂	H	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
	I-214	J-1	CH ₂	H	N	OCF ₂ H	Cl	
	I-215	J-1	CH ₂	H	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
35	I-216	J-1	CH ₂	H	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-217	J-1	CH ₂	H	N	NHCH ₃	Cl	
40	I-218	J-1	CH ₂	H	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
	I-219	J-1	CH ₂	H	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
45	I-220	J-1	CH ₂	H	N	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung) :

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-221	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	
I-222	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-223	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	CH ₃	
I-224	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-225	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	CF ₃	
I-226	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-227	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-228	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-229	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCH ₃	Cl	
I-230	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-231	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-232	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-233	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-234	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-235	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-236	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-237	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-238	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CH ₃	CH ₃	
I-239	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-240	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CH ₃	CF ₃	
I-241	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

5	I-242	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CH ₃	NHCH ₃	
	I-243	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-244	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CH ₃	Cl	
	I-245	J-1	CH ₂	CH ₃	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
10	I-246	J-1	CH ₂	CH ₃	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
	I-247	J-1	CH ₂	CH ₃	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
	I-248	J-1	CH ₂	CH ₃	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
15	I-249	J-1	CH ₂	CH ₃	N	C ₂ H ₅	Cl	
	I-250	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CF ₃	CF ₃	
20	I-251	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-252	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CF ₃	NHCH ₃	
	I-253	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
25	I-254	J-1	CH ₂	CH ₃	N	CF ₃	Cl	
	I-255	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
	I-256	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
30	I-257	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
	I-258	J-1	CH ₂	CH ₃	N	OCF ₂ H	Cl	
	I-259	J-1	CH ₂	CH ₃	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
35	I-260	J-1	CH ₂	CH ₃	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-261	J-1	CH ₂	CH ₃	N	NHCH ₃	Cl	
40	I-262	J-1	CH ₂	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
	I-263	J-1	CH ₂	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
	I-264	J-1	CH ₂	CH ₃	N	Cl	Cl	

45

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-265	J-2	-	H	CH	OCH ₃	OCH ₃	167-168 171-172 ^(*)
I-266	J-2	-	H	CH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	154
I-267	J-2	-	H	CH	OCH ₃	CH ₃	180-181 ^(*)
I-268	J-2	-	H	CH	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-269	J-2	-	H	CH	OCH ₃	CF ₃	
I-270	J-2	-	H	CH	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-271	J-2	-	H	CH	OCH ₃	NHCH ₃	
I-272	J-2	-	H	CH	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	199.5
I-273	J-2	-	H	CH	OCH ₃	Cl	110-111 175-178 ^(*)
I-274	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	152-154 ^(*)
I-275	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-276	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-277	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-278	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-279	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-280	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-281	J-2	-	H	CH	OC ₂ H ₅	Cl	158-159 213 ^(*)
I-282	J-2	-	H	CH	CH ₃	CH ₃	153
I-283	J-2	-	H	CH	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-284	J-2	-	H	CH	CH ₃	CF ₃	
I-285	J-2	-	H	CH	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle I (Fortsetzung):

5	I-286	J-2	-	H	CH	CH ₃	NHCH ₃	
	I-287	J-2	-	H	CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-288	J-2	-	H	CH	CH ₃	Cl	108-109 >300(*)
10	I-289	J-2	-	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-290	J-2	-	H	CH	C ₂ H ₅	CF ₃	
	I-291	J-2	-	H	CH	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
15	I-292	J-2	-	H	CH	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-293	J-2	-	H	CH	C ₂ H ₅	Cl	
	I-294	J-2	-	H	CH	CF ₃	CF ₃	
20	I-295	J-2	-	H	CH	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-296	J-2	-	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
25	I-297	J-2	-	H	CH	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-298	J-2	-	H	CH	CF ₃	Cl	
	I-299	J-2	-	H	CH	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
30	I-300	J-2	-	H	CH	OCF ₂ H	NHCH ₃	
	I-301	J-2	-	H	CH	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
	I-302	J-2	-	H	CH	OCF ₂ H	Cl	
35	I-303	J-2	-	H	CH	NHCH ₃	NHCH ₃	
	I-304	J-2	-	H	CH	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-305	J-2	-	H	CH	NHCH ₃	Cl	
40	I-306	J-2	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
	I-307	J-2	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	
45	I-308	J-2	-	H	CH	Cl	Cl	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-309	J-2	-	H	N	OCH ₃	OCH ₃	255 159-162 ^(*)
I-310	J-2	-	H	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-311	J-2	-	H	N	OCH ₃	CH ₃	
I-312	J-2	-	H	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-313	J-2	-	H	N	OCH ₃	CF ₃	
I-314	J-2	-	H	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-315	J-2	-	H	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-316	J-2	-	H	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	156 ^(*)
I-317	J-2	-	H	N	OCH ₃	Cl	
I-318	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-319	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-320	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-321	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-322	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-323	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-324	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-325	J-2	-	H	N	OC ₂ H ₅	Cl	213 ^(*)
I-326	J-2	-	H	N	CH ₃	CH ₃	
I-327	J-2	-	H	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-328	J-2	-	H	N	CH ₃	CF ₃	
I-329	J-2	-	H	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

I-330	J-2	-	H	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-331	J-2	-	H	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-332	J-2	-	H	N	CH ₃	Cl	
I-333	J-2	-	H	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-334	J-2	-	H	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-335	J-2	-	H	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-336	J-2	-	H	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-337	J-2	-	H	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-338	J-2	-	H	N	CF ₃	CF ₃	
I-339	J-2	-	H	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-340	J-2	-	H	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-341	J-2	-	H	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-342	J-2	-	H	N	CF ₃	Cl	
I-343	J-2	-	H	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-344	J-2	-	H	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-345	J-2	-	H	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-346	J-2	-	H	N	OCF ₂ H	Cl	
I-347	J-2	-	H	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-348	J-2	-	H	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-349	J-2	-	H	N	NHCH ₃	Cl	
I-350	J-2	-	H	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-351	J-2	-	H	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-352	J-2	-	H	N	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-353	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	
I-354	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-355	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	CH ₃	
I-356	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-357	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	CF ₃	
I-358	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-359	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-360	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-361	J-2	-	CH ₃	N	OCH ₃	Cl	
I-362	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-363	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-364	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-365	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-366	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-367	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-368	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-369	J-2	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-370	J-2	-	CH ₃	N	CH ₃	CH ₃	
I-371	J-2	-	CH ₃	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-372	J-2	-	CH ₃	N	CH ₃	CF ₃	
I-373	J-2	-	CH ₃	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle I (Fortsetzung):

I-374	J-2	-	CH ₃	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-375	J-2	-	CH ₃	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-376	J-2	-	CH ₃	N	CH ₃	Cl	
I-377	J-2	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-378	J-2	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-379	J-2	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-380	J-2	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-381	J-2	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-382	J-2	-	CH ₃	N	CF ₃	CF ₃	
I-383	J-2	-	CH ₃	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-384	J-2	-	CH ₃	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-385	J-2	-	CH ₃	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-386	J-2	-	CH ₃	N	CF ₃	Cl	
I-387	J-2	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-388	J-2	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-389	J-2	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-390	J-2	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	Cl	
I-391	J-2	-	CH ₃	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-392	J-2	-	CH ₃	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-393	J-2	-	CH ₃	N	NHCH ₃	Cl	
I-394	J-2	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-395	J-2	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-396	J-2	-	CH ₃	N	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-397	J-3	-	H	CH	OCH ₃	OCH ₃	250 (Z.) ^(*)
I-398	J-3	-	H	CH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-399	J-3	-	H	CH	OCH ₃	CH ₃	
I-400	J-3	-	H	CH	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-401	J-3	-	H	CH	OCH ₃	CF ₃	
I-402	J-3	-	H	CH	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-403	J-3	-	H	CH	OCH ₃	NHCH ₃	
I-404	J-3	-	H	CH	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-405	J-3	-	H	CH	OCH ₃	Cl	
I-406	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-407	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-408	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-409	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-410	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-411	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-412	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-413	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	Cl	
I-414	J-3	-	H	CH	CH ₃	CH ₃	180-2
I-415	J-3	-	H	CH	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-416	J-3	-	H	CH	CH ₃	CF ₃	
I-417	J-3	-	H	CH	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

I-418	J-3	-	H	CH	CH ₃	NHCH ₃	
I-419	J-3	-	H	CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-420	J-3	-	H	CH	CH ₃	Cl	
I-421	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-422	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-423	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-424	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-425	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	Cl	
I-426	J-3	-	H	CH	CF ₃	CF ₃	
I-427	J-3	-	H	CH	CF ₃	OCF ₂ H	
I-428	J-3	-	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
I-429	J-3	-	H	CH	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-430	J-3	-	H	CH	CF ₃	Cl	
I-431	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-432	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-433	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-434	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	Cl	
I-435	J-3	-	H	CH	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-436	J-3	-	H	CH	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-437	J-3	-	H	CH	NHCH ₃	Cl	
I-438	J-3	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-439	J-3	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-440	J-3	-	H	CH	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-441	J-3	-	H	N	OCH ₃	OCH ₃	169-72 (Z.)
I-442	J-3	-	H	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-443	J-3	-	H	N	OCH ₃	CH ₃	190-2 ^(*)
I-444	J-3	-	H	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-445	J-3	-	H	N	OCH ₃	CF ₃	
I-446	J-3	-	H	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-447	J-3	-	H	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-448	J-3	-	H	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-449	J-3	-	H	N	OCH ₃	Cl	
I-450	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-451	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-452	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-453	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-454	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-455	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-456	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-457	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-458	J-3	-	H	N	CH ₃	CH ₃	
I-459	J-3	-	H	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-460	J-3	-	H	N	CH ₃	CF ₃	
I-461	J-3	-	H	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

I-462	J-3	-	H	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-463	J-3	-	H	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-464	J-3	-	H	N	CH ₃	Cl	
I-465	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-466	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-467	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-468	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-469	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-470	J-3	-	H	N	CF ₃	CF ₃	
I-471	J-3	-	H	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-472	J-3	-	H	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-473	J-3	-	H	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-474	J-3	-	H	N	CF ₃	Cl	
I-475	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-476	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-477	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-478	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	Cl	
I-479	J-3	-	H	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-480	J-3	-	H	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-481	J-3	-	H	N	NHCH ₃	Cl	
I-482	J-3	-	H	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-483	J-3	-	H	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-484	J-3	-	H	N	Cl	Cl	

Tabelle I (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-485	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	204 (Zers.)
I-486	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-487	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	CH ₃	
I-488	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-489	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	CF ₃	
I-490	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-491	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-492	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-493	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	Cl	
I-494	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-495	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-496	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-497	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-498	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-499	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-500	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-501	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-502	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	CH ₃	
I-503	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-504	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	CF ₃	
I-505	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

I-506	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-507	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-508	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	Cl	
I-509	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-510	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-511	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-512	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-513	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-514	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	CF ₃	
I-515	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-516	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-517	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-518	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	Cl	
I-519	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-520	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-521	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-522	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	Cl	
I-523	J-3	-	CH ₃	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-524	J-3	-	CH ₃	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-525	J-3	-	CH ₃	N	NHCH ₃	Cl	
I-526	J-3	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-527	J-3	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-528	J-3	-	CH ₃	N	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-529	J-4	-	H	CH	OCH ₃	OCH ₃	185-186 151-152 ^(*)
I-530	J-4	-	H	CH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	174-175 85 ^(*)
I-531	J-4	-	H	CH	OCH ₃	CH ₃	178 165-167 ^(*)
I-532	J-4	-	H	CH	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-533	J-4	-	H	CH	OCH ₃	CF ₃	
I-534	J-4	-	H	CH	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-535	J-4	-	H	CH	OCH ₃	NHCH ₃	
I-536	J-4	-	H	CH	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	92-95 258-262 ^(*)
I-537	J-4	-	H	CH	OCH ₃	Cl	112 185-186 ^(*)
I-538	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	134-137
I-539	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-540	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-541	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-542	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-543	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-544	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-545	J-4	-	H	CH	OC ₂ H ₅	Cl	181-183 171 ^(*)
I-546	J-4	-	H	CH	CH ₃	CH ₃	195 230-232 ^(*)
I-547	J-4	-	H	CH	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-548	J-4	-	H	CH	CH ₃	CF ₃	
I-549	J-4	-	H	CH	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

5	I-550	J-4	-	H	CH	CH ₃	NHCH ₃	
	I-551	J-4	-	H	CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-552	J-4	-	H	CH	CH ₃	Cl	175 138-140(*)
10	I-553	J-4	-	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-554	J-4	-	H	CH	C ₂ H ₅	CF ₃	
	I-555	J-4	-	H	CH	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
15	I-556	J-4	-	H	CH	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-557	J-4	-	H	CH	C ₂ H ₅	Cl	
	I-558	J-4	-	H	CH	CF ₃	CF ₃	
20	I-559	J-4	-	H	CH	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-560	J-4	-	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
25	I-561	J-4	-	H	CH	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-562	J-4	-	H	CH	CF ₃	Cl	
	I-563	J-4	-	H	CH	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
30	I-564	J-4	-	H	CH	OCF ₂ H	NHCH ₃	
	I-565	J-4	-	H	CH	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
	I-566	J-4	-	H	CH	OCF ₂ H	Cl	
35	I-567	J-4	-	H	CH	NHCH ₃	NHCH ₃	
	I-568	J-4	-	H	CH	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-569	J-4	-	H	CH	NHCH ₃	Cl	
40	I-570	J-4	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
	I-571	J-4	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	
45	I-572	J-4	-	H	CH	Cl	Cl	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung):

5	Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
	I-573	J-4	-	H	N	OCH ₃	OCH ₃	179
10	I-574	J-4	-	H	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
	I-575	J-4	-	H	N	OCH ₃	CH ₃	238 ^(*)
	I-576	J-4	-	H	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
15	I-577	J-4	-	H	N	OCH ₃	CF ₃	
	I-578	J-4	-	H	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
	I-579	J-4	-	H	N	OCH ₃	NHCH ₃	
20	I-580	J-4	-	H	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-581	J-4	-	H	N	OCH ₃	Cl	
	I-582	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
25	I-583	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
	I-584	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-585	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
30	I-586	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
	I-587	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-588	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
35	I-589	J-4	-	H	N	OC ₂ H ₅	Cl	
	I-590	J-4	-	H	N	CH ₃	CH ₃	200 177-178 ^(*)
40	I-591	J-4	-	H	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
	I-592	J-4	-	H	N	CH ₃	CF ₃	
45	I-593	J-4	-	H	N	CH ₃	OCF ₂ H	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung):

I-594	J-4	-	H	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-595	J-4	-	H	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-596	J-4	-	H	N	CH ₃	Cl	
I-597	J-4	-	H	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-598	J-4	-	H	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-599	J-4	-	H	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-600	J-4	-	H	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-601	J-4	-	H	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-602	J-4	-	H	N	CF ₃	CF ₃	
I-603	J-4	-	H	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-604	J-4	-	H	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-605	J-4	-	H	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-606	J-4	-	H	N	CF ₃	Cl	
I-607	J-4	-	H	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-608	J-4	-	H	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-609	J-4	-	H	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-610	J-4	-	H	N	OCF ₂ H	Cl	
I-611	J-4	-	H	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-612	J-4	-	H	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-613	J-4	-	H	N	NHCH ₃	Cl	
I-614	J-4	-	H	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-615	J-4	-	H	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-616	J-4	-	H	N	Cl	Cl	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-617	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	97-100 ^(*)
I-618	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-619	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	CH ₃	
I-620	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-621	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	CF ₃	
I-622	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-623	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-624	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-625	J-4	-	CH ₃	N	OCH ₃	Cl	
I-626	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-627	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-628	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-629	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-630	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-631	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-632	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-633	J-4	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-634	J-4	-	CH ₃	N	CH ₃	CH ₃	
I-635	J-4	-	CH ₃	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-636	J-4	-	CH ₃	N	CH ₃	CF ₃	
I-637	J-4	-	CH ₃	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 1 (Fortsetzung):

5	I-638	J-4	-	CH ₃	N	CH ₃	NHCH ₃	
	I-639	J-4	-	CH ₃	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-640	J-4	-	CH ₃	N	CH ₃	Cl	
10	I-641	J-4	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-642	J-4	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
	I-643	J-4	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
15	I-644	J-4	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-645	J-4	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	Cl	
	I-646	J-4	-	CH ₃	N	CF ₃	CF ₃	
20	I-647	J-4	-	CH ₃	N	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-648	J-4	-	CH ₃	N	CF ₃	NHCH ₃	
	I-649	J-4	-	CH ₃	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
25	I-650	J-4	-	CH ₃	N	CF ₃	Cl	
	I-651	J-4	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
	I-652	J-4	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
30	I-653	J-4	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
	I-654	J-4	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	Cl	
35	I-655	J-4	-	CH ₃	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
	I-656	J-4	-	CH ₃	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-657	J-4	-	CH ₃	N	NHCH ₃	Cl	
40	I-658	J-4	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
	I-659	J-4	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
	I-660	J-4	-	CH ₃	N	Cl	Cl	

Tabelle 2: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I) mit $J = J-1$;
 $R^4 = R^5 = R^6 = R^7 = H$ und $R^{10} = 6-CH_3$:

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-661	J-1	-	H	CH	OCH ₃	OCH ₃	
I-662	J-1	-	H	CH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-663	J-1	-	H	CH	OCH ₃	CH ₃	
I-664	J-1	-	H	CH	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-665	J-1	-	H	CH	OCH ₃	CF ₃	
I-666	J-1	-	H	CH	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-667	J-1	-	H	CH	OCH ₃	NHCH ₃	
I-668	J-1	-	H	CH	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-669	J-1	-	H	CH	OCH ₃	Cl	
I-670	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-671	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-672	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-673	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-674	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-675	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-676	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-677	J-1	-	H	CH	OC ₂ H ₅	Cl	
I-678	J-1	-	H	CH	CH ₃	CH ₃	
I-679	J-1	-	H	CH	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-680	J-1	-	H	CH	CH ₃	CF ₃	
I-681	J-1	-	H	CH	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 2 (Fortsetzung):

I-682	J-1	-	H	CH	CH ₃	NHCH ₃	
I-683	J-1	-	H	CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-684	J-1	-	H	CH	CH ₃	Cl	
I-685	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-686	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-687	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-688	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-689	J-1	-	H	CH	C ₂ H ₅	Cl	
I-690	J-1	-	H	CH	CF ₃	CF ₃	
I-691	J-1	-	H	CH	CF ₃	OCF ₂ H	
I-692	J-1	-	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
I-693	J-1	-	H	CH	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-694	J-1	-	H	CH	CF ₃	Cl	
I-695	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-696	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-697	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-698	J-1	-	H	CH	OCF ₂ H	Cl	
I-699	J-1	-	H	CH	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-700	J-1	-	H	CH	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-701	J-1	-	H	CH	NHCH ₃	Cl	
I-702	J-1	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-703	J-1	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-704	J-1	-	H	CH	Cl	Cl	

Tabelle 2 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-705	J-1	-	H	N	OCH ₃	OCH ₃	
I-706	J-1	-	H	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-707	J-1	-	H	N	OCH ₃	CH ₃	
I-708	J-1	-	H	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-709	J-1	-	H	N	OCH ₃	CF ₃	
I-710	J-1	-	H	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-711	J-1	-	H	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-712	J-1	-	H	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-713	J-1	-	H	N	OCH ₃	Cl	
I-714	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-715	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-716	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-717	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-718	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-719	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-720	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-721	J-1	-	H	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-722	J-1	-	H	N	CH ₃	CH ₃	
I-723	J-1	-	H	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-724	J-1	-	H	N	CH ₃	CF ₃	
I-725	J-1	-	H	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 2 (Fortsetzung):

I-726	J-1	-	H	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-727	J-1	-	H	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-728	J-1	-	H	N	CH ₃	Cl	
I-729	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-730	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-731	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-732	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-733	J-1	-	H	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-734	J-1	-	H	N	CF ₃	CF ₃	
I-735	J-1	-	H	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-736	J-1	-	H	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-737	J-1	-	H	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-738	J-1	-	H	N	CF ₃	Cl	
I-739	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-740	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-741	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-742	J-1	-	H	N	OCF ₂ H	Cl	
I-743	J-1	-	H	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-744	J-1	-	H	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-745	J-1	-	H	N	NHCH ₃	Cl	
I-746	J-1	-	H	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-747	J-1	-	H	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-748	J-1	-	H	N	Cl	Cl	

Tabelle 2 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-749	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	
I-750	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-751	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	CH ₃	
I-752	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-753	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	CF ₃	
I-754	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-755	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-756	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-757	J-1	-	CH ₃	N	OCH ₃	Cl	
I-758	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-759	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-760	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-761	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-762	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-763	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-764	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-765	J-1	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-766	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	CH ₃	
I-767	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-768	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	CF ₃	
I-769	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 2 (Fortsetzung):

I-770	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-771	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-772	J-1	-	CH ₃	N	CH ₃	Cl	
I-773	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-774	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-775	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-776	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-777	J-1	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-778	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	CF ₃	
I-779	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-780	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-781	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-782	J-1	-	CH ₃	N	CF ₃	Cl	
I-783	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-784	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-785	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-786	J-1	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	Cl	
I-787	J-1	-	CH ₃	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-788	J-1	-	CH ₃	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-789	J-1	-	CH ₃	N	NHCH ₃	Cl	
I-790	J-1	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-791	J-1	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-792	J-1	-	CH ₃	N	Cl	Cl	

Tabelle 3 Beispiele für die Verbindungen der Formel (I) mit J = J-3;
 $R^4 = R^5 = R^6 = R^7 = H$; $R^8 = CH_3$ und $R^{10} = Cl$:

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-793	J-3	-	H	CH	OCH ₃	OCH ₃	243 ^(*)
I-794	J-3	-	H	CH	OCH ₃	OC ₂ H ₅	117-120 187-190 ^(*)
I-795	J-3	-	H	CH	OCH ₃	CH ₃	188-194 214 ^(*)
I-796	J-3	-	H	CH	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-797	J-3	-	H	CH	OCH ₃	CF ₃	
I-798	J-3	-	H	CH	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-799	J-3	-	H	CH	OCH ₃	NHCH ₃	
I-800	J-3	-	H	CH	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-801	J-3	-	H	CH	OCH ₃	Cl	177-178 200-201 ^(*)
I-802	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	187-193
I-803	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-804	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-805	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-806	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-807	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-808	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-809	J-3	-	H	CH	OC ₂ H ₅	Cl	173-175 218 ^(*)
I-810	J-3	-	H	CH	CH ₃	CH ₃	193-194 228-230 ^(*)
I-811	J-3	-	H	CH	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-812	J-3	-	H	CH	CH ₃	CF ₃	
I-813	J-3	-	H	CH	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 3 (Fortsetzung):

I-814	J-3	-	H	CH	CH ₃	NHCH ₃	
I-815	J-3	-	H	CH	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-816	J-3	-	H	CH	CH ₃	Cl	190 205 ^(*)
I-817	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-818	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-819	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-820	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-821	J-3	-	H	CH	C ₂ H ₅	Cl	
I-822	J-3	-	H	CH	CF ₃	CF ₃	
I-823	J-3	-	H	CH	CF ₃	OCF ₂ H	
I-824	J-3	-	H	CH	CF ₃	NHCH ₃	
I-825	J-3	-	H	CH	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-826	J-3	-	H	CH	CF ₃	Cl	
I-827	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-828	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-829	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-830	J-3	-	H	CH	OCF ₂ H	Cl	
I-831	J-3	-	H	CH	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-832	J-3	-	H	CH	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-833	J-3	-	H	CH	NHCH ₃	Cl	
I-834	J-3	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-835	J-3	-	H	CH	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-836	J-3	-	H	CH	Cl	Cl	

Tabelle 3 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-837	J-3	-	H	N	OCH ₃	OCH ₃	172 218 ⁽⁺⁾
I-838	J-3	-	H	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-839	J-3	-	H	N	OCH ₃	CH ₃	190-192 ⁽⁺⁾
I-840	J-3	-	H	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-841	J-3	-	H	N	OCH ₃	CF ₃	
I-842	J-3	-	H	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-843	J-3	-	H	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-844	J-3	-	H	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-845	J-3	-	H	N	OCH ₃	Cl	
I-846	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-847	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-848	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-849	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-850	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-851	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-852	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-853	J-3	-	H	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-854	J-3	-	H	N	CH ₃	CH ₃	151-153 130-135 ⁽⁺⁾
I-855	J-3	-	H	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-856	J-3	-	H	N	CH ₃	CF ₃	
I-857	J-3	-	H	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 3 (Fortsetzung):

5	I-858	J-3	-	H	N	CH ₃	NHCH ₃	
	I-859	J-3	-	H	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-860	J-3	-	H	N	CH ₃	Cl	
10	I-861	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	I-862	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
	I-863	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
15	I-864	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
	I-865	J-3	-	H	N	C ₂ H ₅	Cl	
	I-866	J-3	-	H	N	CF ₃	CF ₃	
20	I-867	J-3	-	H	N	CF ₃	OCF ₂ H	
	I-868	J-3	-	H	N	CF ₃	NHCH ₃	
	I-869	J-3	-	H	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
25	I-870	J-3	-	H	N	CF ₃	Cl	
	I-871	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
	I-872	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
30	I-873	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
	I-874	J-3	-	H	N	OCF ₂ H	Cl	
	I-875	J-3	-	H	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
35	I-876	J-3	-	H	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
	I-877	J-3	-	H	N	NHCH ₃	Cl	
	I-878	J-3	-	H	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
40	I-879	J-3	-	H	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
	I-880	J-3	-	H	N	Cl	Cl	

Tabelle 3 (Fortsetzung):

Bsp.- Nr.	J	E	R ¹	A	R ²	R ³	Smp. (° C)
I-881	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	172-173 110-114 ^(*)
I-882	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	
I-883	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	CH ₃	
I-884	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	C ₂ H ₅	
I-885	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	CF ₃	
I-886	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	OCF ₂ H	
I-887	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	NHCH ₃	
I-888	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-889	J-3	-	CH ₃	N	OCH ₃	Cl	
I-890	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	
I-891	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CH ₃	
I-892	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-893	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	
I-894	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-895	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-896	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	
I-897	J-3	-	CH ₃	N	OC ₂ H ₅	Cl	
I-898	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	CH ₃	
I-899	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	C ₂ H ₅	
I-900	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	CF ₃	
I-901	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	OCF ₂ H	

Tabelle 3 (Fortsetzung):

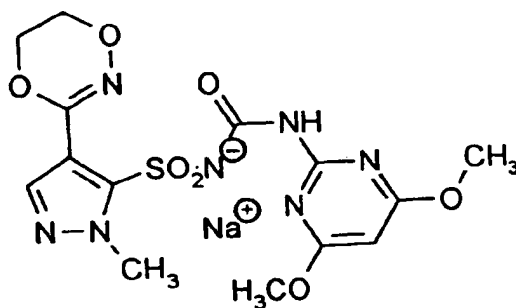
I-902	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	NHCH ₃	
I-903	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-904	J-3	-	CH ₃	N	CH ₃	Cl	
I-905	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
I-906	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	CF ₃	
I-907	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	OCF ₂ H	
I-908	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	NHCH ₃	
I-909	J-3	-	CH ₃	N	C ₂ H ₅	Cl	
I-910	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	CF ₃	
I-911	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	OCF ₂ H	
I-912	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	NHCH ₃	
I-913	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	N(CH ₃) ₂	
I-914	J-3	-	CH ₃	N	CF ₃	Cl	
I-915	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	OCF ₂ H	
I-916	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	NHCH ₃	
I-917	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	N(CH ₃) ₂	
I-918	J-3	-	CH ₃	N	OCF ₂ H	Cl	
I-919	J-3	-	CH ₃	N	NHCH ₃	NHCH ₃	
I-920	J-3	-	CH ₃	N	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂	
I-921	J-3	-	CH ₃	N	NHCH ₃	Cl	
I-922	J-3	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂	
I-923	J-3	-	CH ₃	N	N(CH ₃) ₂	Cl	
I-924	J-3	-	CH ₃	N	Cl	Cl	

Tabelle 4

Beispiele für die Verbindungen der Formel (I) mit $R^1 = R^4 = R^5 = R^6 = R^7 = R^{10} = H$							
Bsp. Nr	J	E	A	R^2	R^3	R^8	Smp. (°C)
I-925	J-1	-	CH	OC_6H_5	CH_3	-	105-109 188-190 ⁽⁺⁾
I-926	J-1	-	CH	Cl	OCH_2CF_3	-	111 120-124 ⁽⁺⁾
I-927	J-2	-	N	$N(CH_3)_2$	OCH_2CF_3	-	158
I-928	J-2	-	CH	Cl	OCH_2CF_3	-	204-205 207 ⁽⁺⁾
I-929	J-3	-	CH	Cl	OCH_2CF_3	CH_3	110 214-218 ⁽⁺⁾
I-930	J-3	-	N	$N(CH_3)_2$	OCH_2CF_3	CH_3	183-184 214-216 ⁽⁺⁾
I-931	J-3	-	CH	CH_3	OC_6H_5	CH_3	195-198 248-249 ⁽⁺⁾
I-932	J-4	-	CH	Cl	OCH_2CF_3	-	115-118 166 ⁽⁺⁾
I-933	J-4	-	N	$N(CH_3)_2$	OCH_2CF_3	-	173-174
I-934	J-4	-	CH	CH_3	OC_6H_5	-	104-108 184 ⁽⁺⁾

Salze von Verbindungen der Formel (I):

Beispiel I-397-a:



0.5 g (0.01 Mol) 80%iges Natriumhydroxid-Pulver werden unter Rühren zu einer Mischung aus 4.3 g (0.01 Mol) N-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-N'-(1-methyl-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyrazol-5-sulfonyl)-harnstoff und 100 ml Toluol gegeben. Das Gemisch wird 15 Stunden bei 20 °C gerührt; anschließend wird das kristalline Produkt durch Absaugen isoliert.

Man erhält 4.5 g (99% der Theorie) N-(4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl)-N'-(1-methyl-4-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-pyrazol-5-sulfonyl)-harnstoff-Na-Salz vom Schmelzpunkt 250 °C (unter Zersetzung).

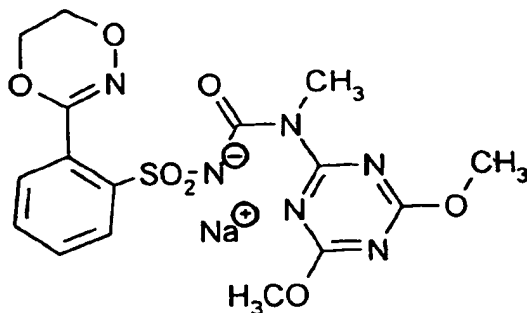
Analog erhält man:

Beispiel I-89-a

5

10

15



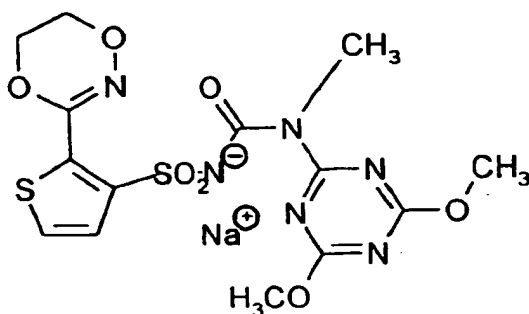
20 N-(4,6-Dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)-N-methyl-N'-(2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzoylsulfonyl)-
harnstoff-Na-Salz. Schmelzpunkt 146 - 149 °C.

Beispiel I-617-a

25

30

35

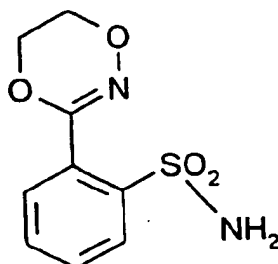


40 N-(4,6-Dimethoxy-1,3,5-triazin-2-yl)-N-methyl-N'-(2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-thiophen-3-sulfonyl)-
harnstoff-Na-Salz. Schmelzpunkt 97 - 100 °C.

45

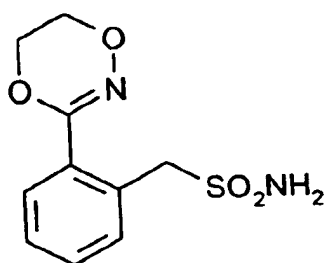
50

55

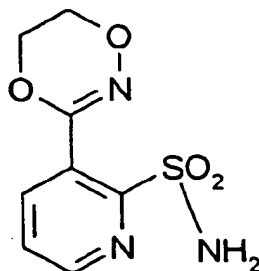
Ausgangsstoffe der Formel (II)Beispiel (II-1)(Verfahren (d))

In eine Mischung aus 22.7 g (0.0795 Mol) 1-Benzylthio-2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzol in 150 ml Dichlormethan und 70 g Natriumdihydrogenphosphat-Hydrat in 150 ml Wasser wird bei 0 °C bis zur Sättigung Chlor eingeleitet. Anschließend trennt man die Phasen, trocknet die organische Phase und zieht das Lösungsmittel bei vermindertem Druck ab. Das hierbei gebildete Sulfonylchlorid wird in 50 ml absolutem Tetrahydrofuran aufgenommen und bei -40 °C zu einer Mischung aus 500 ml Tetrahydrofuran und 50 ml Ammoniak getropft. Man rührt bei Raumtemperatur 2 Stunden weiter und saugt dann die ausgefallenen Salze ab. Das Filtrat wird bei vermindertem Druck vom Lösungsmittel befreit und der Rückstand chromatographiert (Eluenten: 1. Dichlormethan, 2. Cyclohexan/Essigsäureethylester 1:1). Man erhält 11.5 g (60% der Theorie) 2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzylsulfonamid als blaßgelben Feststoff. Schmelzpunkt: 131-133 °C.

Analog erhält man:

Beispiel II-2

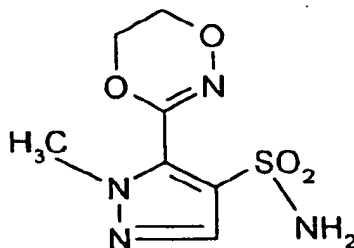
2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)phenylmethansulfonamid. Schmelzpunkt:..... °C

Beispiel II-3

3-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-pyridin-2-sulfonamid. Schmelzpunkt: 170 °C.

Beispiel II-4

(Verfahren (e))

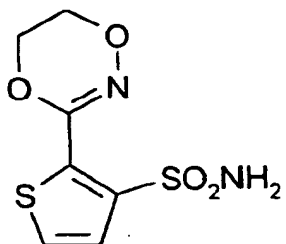


Zu einer Mischung aus 7.78 g (0.112 Mol) Hydroxylamin-Hydrochlorid und 150 ml Methanol tropft man bei Raumtemperatur 6.28 g (0.112 Mol) Kaliumhydroxid in 100 ml Methanol. Anschließend gibt man bei Raumtemperatur 13.1 g (0.056 Mol) 1-Methyl-5-ethoxycarbonylpyrazol-4-sulfonamid portionsweise zu. Man rührt über Nacht bei Raumtemperatur und anschließend 2 Stunden bei 40 °C und weitere 2 Stunden bei 60 °C. Man läßt 3.14 g (0.056 Mol) Kaliumhydroxid in 50 ml Methanol zutropfen und rührt weitere 2 Stunden bei 60 °C. Dann gibt man 7.74 g (0.056 Mol) Kaliumcarbonat zu, tropft 50.5 g (0.25 Mol) 1,2-Dibromethan (BrCH₂CH₂Br) zu und läßt über Nacht bei 60 °C nachrühren. Anschließend wird das Lösungsmittel bei vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird zwischen Methylenchlorid und Wasser verteilt. Die organische Phase wird getrocknet und das Lösungsmittel bei vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird chromatographiert (Eluent: Cyclohexan/Essigsäureethylester 2:3).

Man erhält 5.91 g (43% der Theorie) 1-Methyl-5-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)pyrazol-4-sulfonamid als blaßgelben Feststoff. Schmelzpunkt: 126 - 130 °C.

Analog erhält man:

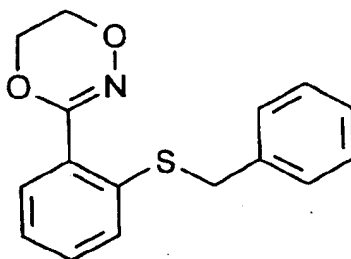
Beispiel II-5



2-(5,6-Dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-thiophen-3-sulfonamid. Schmelzpunkt: 180-184 °C.

Ausgangsstoffe der Formel (VII)

Beispiel VII-1

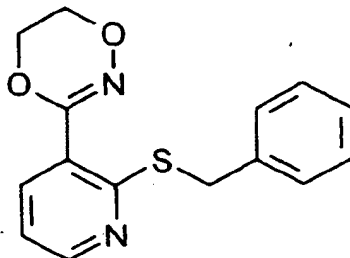


Zu einer Mischung aus 98.7 g (1.42 Mol) Hydroxylamin-Hydrochlorid und 700 ml Methanol tropft man bei Raumtemperatur 160 g (2.86 Mol) Kaliumhydroxid in 700 ml Methanol. Anschließend gibt man bei Raumtemperatur 184 g (0.712 Mol) 2-(Benzylthio)benzoesäuremethylester portionsweise zu. Man rührt über Nacht bei 40 °C. Dann gibt man 98.1 g (0.712 Mol) Kaliumcarbonat zu, tropft 601 g (3.20 Mol) 1,2-Dibromethan zu und läßt über Nacht bei 60 °C nachrühren. Anschließend wird das Lösungsmittel bei vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird zwischen Methylenchlorid und Wasser verteilt. Die organische Phase wird getrocknet und das Lösungsmittel bei vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit absolutem Ethylalkohol verrührt. Der Feststoff wird abgesaugt und im Hochvakuum getrocknet.

Man erhält 43.1 g (21% der Theorie) 1-Benzylthio-2-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-benzol als blaß-gelben Feststoff. Schmelzpunkt: 73 - 77 °C.

Analog erhält man:

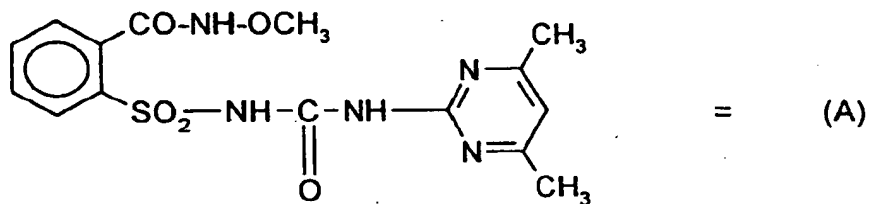
Beispiel VII-2



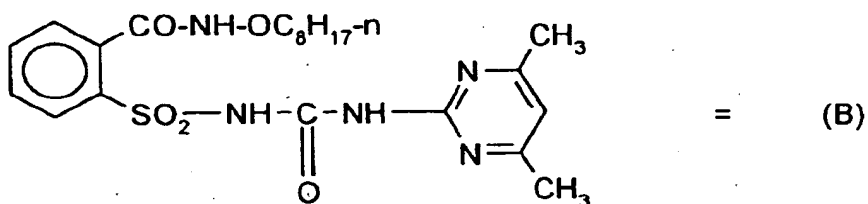
2-Benzylthio-3-(5,6-dihydro-[1,4,2]-dioxazin-3-yl)-pyridin. Schmelzpunkt: 65.5-67.5 °C.

Anwendungsbeispiele:

In den folgenden Anwendungsbeispielen werden die nachstehend aufgeführten Verbindungen als Vergleichsverbindungen herangezogen:



N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-N'-(2-methoxyaminocarbonyl-phenylsulfonyl)-harnstoff, und



N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-N'-(2-n-octyloxyaminocarbonyl-phenylsulfonyl)-harnstoff,
(beide bekannt von DE-A-3 516 435, Beispiele 1 bzw. 2).

Beispiel A

Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät und nach 24 Stunden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in %

5 Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen gemäß folgender Herstellungsbeispiele: (I-1), (I-9), (I-18), (I-47).

10

Beispiel B

Post-emergence-Test

15 Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

20 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 2000 l Wasser/ha die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

25

Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

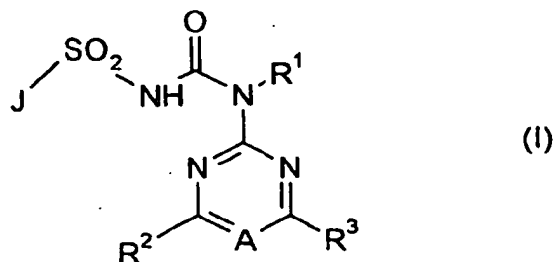
30 Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen gemäß folgender Herstellungsbeispiele: (I-1), (I-18), (I-47), (I-89a), (I-397), (I-414), (I-485).

Patentansprüche

35

1. N-Azinyln-N'-(het)arylsulfonyl-harnstoffe der Formel (I),

40



45

50 in welcher

A für Stickstoff oder eine CR¹¹-Gruppierung steht, wobei

R¹¹ für Wasserstoff, Alkyl, Halogen und Haloalkyl steht,

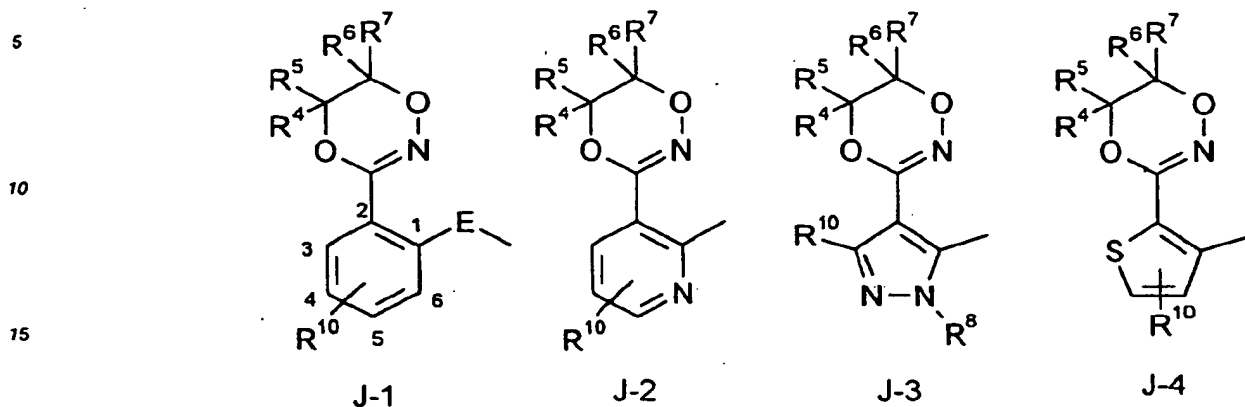
R¹ für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aralkyl und Aryl steht,

55

R² für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,

R³ für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl,

J Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, für J-1 bis J-4 steht, wobei J-1 bis J-4 folgende Bedeutungen haben:



20 worin

- E für eine direkte Bindung, Alkylen, Sauerstoff, Alkylamino oder Schwefel steht,
 R⁴-R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen stehen,
 R⁸ für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aralkyl und Aryl oder für eine Gruppe C(=O)-R⁹ steht, wobei
 R⁹ für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl, Alkoxy, Alkylamino oder Dialkylamino steht,
 R¹⁰ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht,

35 wobei in den vorgenannten Resten die Alkyl- und Alkylengruppen jeweils 1 bis 6 C-Atome, die Alkenyl- und Alkynylgruppen jeweils 2 bis 6 C-Atome, die Cycloalkylgruppen jeweils 3 bis 6 C-Atome und die Arylgruppen jeweils 6 bzw. 10 C-Atome enthalten können, sowie Salze von Verbindungen der Formel (I).

2. Sulfonylharnstoffe der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß darin

- A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,
 R¹ für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls durch Halogen substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkenyl und Alkynyl mit jeweils bis zu 3 Kohlenstoffatomen steht,
 R² für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylresten steht,
 R³ für Wasserstoff, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylresten steht,
 J für J-1 bis J-4 steht,
 E für eine direkte Bindung, Methylen, Sauerstoff, Alkylamino mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen oder Schwefel steht,
 R⁴-R⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl oder Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylresten steht,

- R^8 für Wasserstoff oder einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_7 - C_{11} -Aryl und C_6 - C_{10} -Aryl steht.
 R^{10} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Thiocyanato oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl oder Alkylaminocarbonyl mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den Alkylresten steht.

3. Sulfonylharnstoffe der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß darin

- A für Stickstoff oder eine CH-Gruppierung steht,
 R^1 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methoxymethyl oder Ethoxy steht,
 R^2 für Wasserstoff, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluoromethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluoromethoxy, Methylthio, Methylamino oder Dimethylamino steht,
 R^3 für Wasserstoff, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluoromethyl, Methoxy, Ethoxy, Difluoromethoxy, Methylthio, Methylamino oder Dimethylamino steht,
J für J-1 bis J-4 steht,
E für eine direkte Bindung, Methylen, Sauerstoff, C_1 - C_2 -Alkylamino oder Schwefel steht,
 R^4 - R^7 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Cyano, oder für jeweils gegebenenfalls durch Chlor oder Fluor substituiertes Methyl, Methylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl steht,
 R^8 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Phenyl oder Benzyl steht,
 R^{10} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls durch Chlor oder Fluor substituiertes Methyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfonyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Methyl- oder Dimethylamino steht.

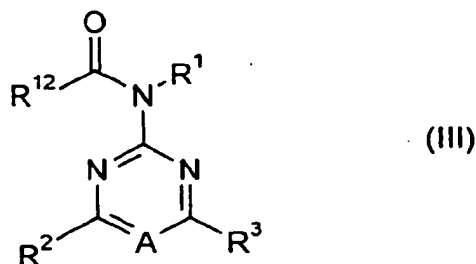
4. Verfahren zur Herstellung von N-Azinyln'- (het)arylsulfonylharnstoffen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man

(a) (Het)arylsulfonamide der allgemeinen Formel (II),



in welcher

J die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat, mit N-Azinyldisubstituten der Formel (III),



in welcher

A und R^1 - R^3 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, und R^{12} für Alkyl oder Aryl steht,

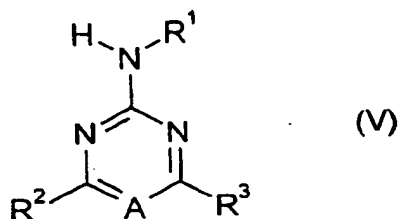
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt, oder daß man

(b) (Het)arylsulfonylisocyanate der allgemeinen Formel (IV),



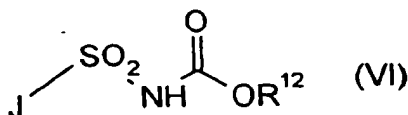
in welcher

J die oben angegebenen Bedeutungen hat, mit Aminoazinen der Formel (V),



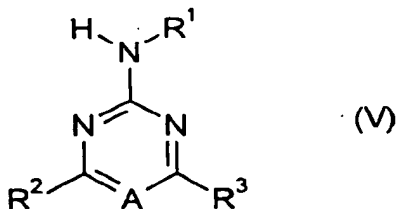
in welcher

A und $\text{R}^1 - \text{R}^3$ die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt, oder daß man
(c) N-(Het)arylsulfonylcarbamate der allgemeinen Formel (VI),



in welcher

J und R^{12} die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Aminoazinen der Formel (V),



in welcher

A und $\text{R}^1 - \text{R}^3$ die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels umgesetzt, und gegebenenfalls die nach Verfahren (a), (b) oder (c) erhaltenen Produkte nach üblichen Methoden in Salze überführt.

5. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1.

6. Verwendung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwachstum.

7. Verfahren zur Bekämpfung von Unkräutern, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Unkräuter oder ihren Lebensraum einwirken läßt.

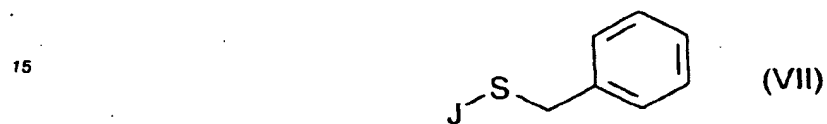
8. Verfahren zur Herstellung von herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.

9. (Het)arylsulfonylverbindungen der Formel (XI),



- 5 in welcher
J die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen hat und
G für $-NH_2$, $-N=C=O$ oder $-NH-COOR^{12}$ steht,
wobei
R¹² für Alkyl oder Aryl steht.

10 10. (Het)arylthiobenzylether der Formel (VII)



- 20 in welcher
J die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen hat.

25

30

35

40

45

50

55



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung
EP 94 11 4445

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.6)
X,D	EP-A-0 301 784 (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 1. Februar 1989 * Seite 87, Verbindungen 43-48 * * Seite 29 - Seite 31 * ---	1-8	C07D413/12 C07D413/14 A01N47/36
A,D	EP-A-0 173 958 (BAYER AG) 12. März 1986 * Beispiele * ---	1-8	
A	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 114, no. 9, 4. März 1991, Columbus, Ohio, US; abstract no. 77044x, H. OYAMA ET AL. 'Preparation of 5,6-dihydro-1,4,2-dioxazines as herbicides' Seite 267 ; * Zusammenfassung * & JP-A-02 233 602 (HOKKO CHEMICAL INDUSTRY CO.) 17. September 1990 -----		
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.6)
			C07D
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt			
Recherchenort DEN HAAG		Abschließdatum der Recherche 4. Januar 1995	Prüfer De Jong, B
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE			
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung F : Zwischenliteratur		T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus anderen Gründen angeführtes Dokument A : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument	

EPO FORM 1303 (11/91) (P4/C6)